

IN THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

APPLICANT: Il Hwan Cho, et al. )  
FOR: 1, 2, 4-TRIAZOLE DERIVATIVE, METHOD )  
FOR PREPARING THE SAME, AND )  
PHARMACEUTICAL COMPOSITION )  
CONTAINING THE SAME )

CLAIM FOR PRIORITY

Mail Stop Patent Application  
Commissioner for Patents  
P.O. Box 1450  
Alexandria, VA 22313-1450


Dear Commissioner:

Enclosed herewith is a certified copy of Korean Patent Application No. 2002-0046551 filed on August 7, 2002. The enclosed Application is directed to the invention disclosed and claimed in the above-identified application.

Applicant hereby claims the benefit of the filing date of August 7, 2002, of the Korean Patent Application No. 2002-0046551, under provisions of 35 U.S.C. 119 and the International Convention for the protection of Industrial Property.

Respectfully submitted,

CANTOR COLBURN LLP

By:   
Soonja Bae  
Reg. No. (PLEASE SEE ATTACHED)  
Cantor Colburn LLP  
55 Griffin Road South  
Bloomfield, CT 06002  
Telephone: (860) 286-2929  
Fax: (860) 286-0115  
PTO Customer No. 23413

Date: June 27, 2003

**KOREAN INTELLECTUAL  
PROPERTY OFFICE**

This is to certify that the following application annexed hereto is a true copy from the records of the Korean Intellectual Property Office.

Application Number: Korean Patent 2002-0046551

Date of Application: 07 August 2002

Applicant(s): CJ Corp.

13 March 2003

**COMMISSIONER**

[Bibliography]

[Document Name]	Change to informative data of applicant
[Receiver]	Commissioner
[Filing Date]	25 October 2002
[Applicant]	
[Name]	CJ Corporation
[Applicant code]	1-1998-003466-9
[Items to be changed]	
[Changed Item]	Korean Name
[Before change]	Cheil Jedang Corporation
[After change]	CJ Corporation
[Items to be changed]	
[Changed Item]	English Name
[Before change]	Cheil Jedang Corporation
[After change]	CJ Corporation
[Items to be changed]	
[Changed Item]	Registered Seal
[Before change]	
[After change]	
[Purpose]	We notice as above according to Art. 9 of the Patent Law, Art. 12 of the Utility Model Law, Art. 28 of the Design Law and Art. 23 of the Trademark Law.



별첨 사본은 아래 출원의 원본과 동일함을 증명함.

This is to certify that the following application annexed hereto  
is a true copy from the records of the Korean Intellectual  
Property Office.

출원번호 : 10-2002-0046551  
Application Number

출원년월일 : 2002년 08월 07일  
Date of Application AUG 07, 2002

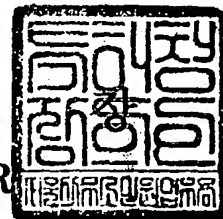
출원인 : 씨제이 주식회사  
Applicant(s) CJ Corp.



2003      년      03      월      13      일

특      허      청

COMMISSIONER





출력 일자: 2003/3/14

**【서지사항】**

**【서류명】** 출원인정보변경 (경정)신고서  
**【수신처】** 특허청장  
**【제출일자】** 20021025

**【출원인】**

**【명칭】** 씨제이 주식회사  
**【출원인코드】** 119980034669

**【변경(경정)사항】**

**【변경(경정)항목】** 한글 성명(명칭)  
**【변경(경정)전】** 제일제당주식회사  
**【변경(경정)후】** 씨제이 주식회사

**【변경(경정)사항】**

**【변경(경정)항목】** 영문 성명(명칭)  
**【변경(경정)전】** CHEIL JEDANG CORPORATION  
**【변경(경정)후】** CJ Corp.

**【변경(경정)사항】**

**【변경(경정)항목】** 인감  
**【변경(경정)전】**  
**【변경(경정)후】**

**【취지】**

특허법시행규칙 제9조·실용신안법시행규칙 제12조·  
의장법시행규칙 제28조 및 상표법시행규칙 제23조의  
규정에 의하여 위와 같이 신고합니다.

## 【서지사항】

【서류명】	특허출원서
【권리구분】	특허
【수신처】	특허청장
【참조번호】	0031
【제출일자】	2002.08.07
【국제특허분류】	C07D
【발명의 명칭】	1,2,4- 트리아졸 유도체, 그 제조방법 및 약제학적 조성물
【발명의 영문명칭】	1,2,4-Triazole derivatives, processes for the preparation thereof, and pharmaceutical compositions containing the same
【출원인】	
【명칭】	제일제당 주식회사
【출원인코드】	1-1998-003466-9
【대리인】	
【성명】	이영필
【대리인코드】	9-1998-000334-6
【포괄위임등록번호】	2000-021089-8
【대리인】	
【성명】	이태호
【대리인코드】	9-1998-000335-2
【포괄위임등록번호】	2002-008457-9
【대리인】	
【성명】	오국진
【대리인코드】	9-1999-000562-6
【포괄위임등록번호】	2002-049689-9
【발명자】	
【성명의 국문표기】	조일환
【성명의 영문표기】	CHO, Il Hwan
【주민등록번호】	610102-1051711
【우편번호】	157-200
【주소】	서울특별시 강서구 가양동 한강타운아파트 104동 102호
【국적】	KR

## 【발명자】

【성명의 국문표기】 박현정  
 【성명의 영문표기】 PARK, Hyun Jung  
 【주민등록번호】 761114-2482624  
 【우편번호】 561-752  
 【주소】 전라북도 전주시 덕진구 동산동 우신아파트 102동 811호  
 【국적】 KR

## 【발명자】

【성명의 국문표기】 노차영  
 【성명의 영문표기】 NOH, Ji Young  
 【주민등록번호】 751022-2120112  
 【우편번호】 609-392  
 【주소】 부산광역시 금정구 장전2동 벽산그린빌라 503호  
 【국적】 KR

## 【발명자】

【성명의 국문표기】 유형철  
 【성명의 영문표기】 RYU, Hyung Chul  
 【주민등록번호】 730420-1476449  
 【우편번호】 449-905  
 【주소】 경기도 용인시 기흥읍 상갈리 상갈아파트 601동 511호  
 【국적】 KR

## 【발명자】

【성명의 국문표기】 박상욱  
 【성명의 영문표기】 PARK, Sang Wook  
 【주민등록번호】 710517-1029418  
 【우편번호】 442-756  
 【주소】 경기도 수원시 팔달구 원천동 원천주공2단지 201동 1505호  
 【국적】 KR

## 【발명자】

【성명의 국문표기】 정성학  
 【성명의 영문표기】 JUNG, Sung Hak  
 【주민등록번호】 711120-1841211

【우편번호】	135-966
【주소】	서울특별시 강남구 개포1동 주공아파트 47동 402호
【국적】	KR
【발명자】	
【성명의 국문표기】	이성학
【성명의 영문표기】	LEE, Sung Hak
【주민등록번호】	701026-1647921
【우편번호】	449-756
【주소】	경기도 용인시 수지읍 현대아파트 103동 1004호
【국적】	KR
【발명자】	
【성명의 국문표기】	김종훈
【성명의 영문표기】	KIM, Jong Hoon
【주민등록번호】	690404-1017211
【우편번호】	431-060
【주소】	경기도 안양시 동안구 관양동 1587 공작럭키아파트 503동 503호
【국적】	KR
【발명자】	
【성명의 국문표기】	임지웅
【성명의 영문표기】	LIM, Jee Woong
【주민등록번호】	670120-1041820
【우편번호】	435-040
【주소】	경기도 군포시 산본동 주몽아파트 1025동 402호
【국적】	KR
【발명자】	
【성명의 국문표기】	류춘선
【성명의 영문표기】	LYU, Chun Seon
【주민등록번호】	650804-1064117
【우편번호】	449-905
【주소】	경기도 용인시 기흥읍 상갈리 479번지 금화마을 주공그린빌 201동 20 1호
【국적】	KR

## 【발명자】

【성명의 국문표기】 김달현  
【성명의 영문표기】 KIM,Dal Hyun  
【주민등록번호】 620625-1018323  
【우편번호】 442-745  
【주소】 경기도 수원시 팔달구 영통동 황골마을풍림아파트 231동 2003호  
【국적】 KR

## 【발명자】

【성명의 국문표기】 김영훈  
【성명의 영문표기】 KIM,Young Hoon  
【주민등록번호】 620912-1009318  
【우편번호】 150-797  
【주소】 서울특별시 영등포구 영등포1동 대우아파트 103동 902호  
【국적】 KR

## 【발명자】

【성명의 국문표기】 연규정  
【성명의 영문표기】 YEON,Kyu Jeong  
【주민등록번호】 621010-1452432  
【우편번호】 449-912  
【주소】 경기도 용인시 구성면 마북리 524-8 연원마을 삼호벽산아파트 126동8 01호  
【국적】 KR

## 【발명자】

【성명의 국문표기】 채명윤  
【성명의 영문표기】 CHAE,Myeong Yun  
【주민등록번호】 601125-1790216  
【우편번호】 463-781  
【주소】 경기도 성남시 분당구 수내동(푸른마을) 쌍용아파트 603동 402호  
【국적】 KR

## 【발명자】

【성명의 국문표기】 민인기  
【성명의 영문표기】 MIN,In Ki

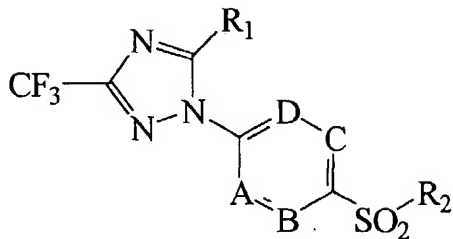
【주민등록번호】	590219-1381011
【우편번호】	449-903
【주소】	경기도 용인시 기흥읍 구갈리 344번지 가현마을 신안아파트 601동 40 2호
【국적】	KR
【발명자】	
【성명의 국문표기】	진해탁
【성명의 영문표기】	JIN,Hae Tak
【주민등록번호】	600327-1101114
【우편번호】	449-709
【주소】	경기도 용인시 김량장동 현대아파트 105동 1406호
【국적】	KR
【발명자】	
【성명의 국문표기】	강경래
【성명의 영문표기】	KANG,Kyoung Rae
【주민등록번호】	490303-1063821
【우편번호】	157-010
【주소】	서울특별시 강서구 화곡동 1003-22 영운아파트 라동 403호
【국적】	KR
【심사청구】	청구
【취지】	특허법 제42조의 규정에 의한 출원, 특허법 제60조의 규정에 의한 출원심사를 청구합니다. 대리인 이영필 (인) 대리인 이태호 (인) 대리인 오국진 (인)
【수수료】	
【기본출원료】	20 면 29,000 원
【가산출원료】	123 면 123,000 원
【우선권주장료】	0 건 0 원
【심사청구료】	11 항 461,000 원
【합계】	613,000 원
【첨부서류】	1. 요약서·명세서(도면)_1통

## 【요약서】

## 【요약】

본 발명은 하기 화학식 1로 표시되는 디아릴 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염, 이들의 제조방법, 및 이들을 유효성분으로 포함하는 약제학적 조성물에 관한 것이다.

## 【화학식 1】



본 발명에 따르면 해열, 진통, 소염작용을 가지며 부작용이 개선된 디아릴 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염 및 이들의 제조방법 그리고 이들을 함유한 약제학적 조성물을 제공할 수 있다.

## 【명세서】

## 【발명의 명칭】

1,2,4-트리아졸 유도체, 그 제조방법 및 약제학적 조성물{1,2,4-Triazole derivatives, processes for the preparation thereof, and pharmaceutical compositions containing the same}

## 【발명의 상세한 설명】

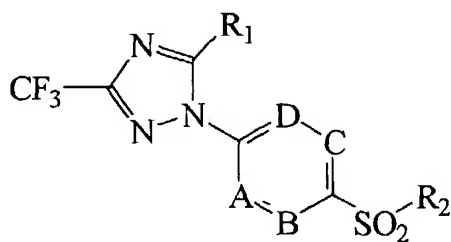
## 【발명의 목적】

## 【발명이 속하는 기술분야 및 그 분야의 종래기술】

<1> 본 발명은 하기 화학식 1로 표시되는 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염, 이들의 제조방법, 및 이들을 유효성분으로 포함하는 약제학적 조성물에 관한 것이다.

## &lt;2&gt; [화학식 1]

&lt;3&gt;



<4> 상기 화학식 1에서,

<5> R<sub>1</sub>은 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> 시클로알킬; C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> 시클로알케닐; 페닐; C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>

할로알킬, C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 알콕시, C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 할로알콕시, 할로젠, 아미노, 모노알킬아미노, 디알킬아미노, 니트로, 및 시아노로 이루어진 군으로부터 선택된 기로 하나 이상 치환된 페닐; 스티레닐; C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 알콕시 스티레닐; 피리딜이고,



- <6> R<sub>2</sub>는 메틸 또는 아미노이고,
- <7> A,B,C, 및 D는 각각 독립적으로 탄소 또는 질소를 나타낸다.
- <8> 비스테로이드성 항염증제의 대부분은 사이클로옥시게나제(COX) 또는 프로스타글란딘 G/H 신타제라 불리는 효소의 저해를 통해 그들의 항염증, 진통, 해열 작용을 나타내며, 또한 호르몬에 의해 일어나는 자궁 수축을 저해하고 몇몇 종류의 암의 성장을 저해한다. 처음에는 소에서 발견된 구성적 효소인 사이클로옥시게나제-1만이 알려져 있었는데, 최근에 유발성 형태의 사이클로옥시게나제-2가 밝혀졌다. 사이클로옥시게나제-2는 사이클로옥시게나제-1과는 확실히 다르며, 마이토젠, 내독소, 호르몬, 성장인자 및 싸이토카인 등에 의해 쉽게 유발된다.
- <9> 프로스타글란딘은 병리학적 및 생리학적 역할을 하는데, 구성적 효소인 사이클로옥시게나제-1은 기본적인 내인성 프로스타글란딘의 분비에 관여하고 위장의 상태 유지 및 신장의 혈액 순환 등 생리학적인 측면에서 중요한 역할을 한다. 반면에, 사이클로옥시게나제-2는 염증인자, 호르몬, 성장인자 및 싸이토카인 등에 의해 유발되며, 따라서 프로스타글란딘의 병리학적인 효과에 주된 역할을 한다. 그러므로 사이클로옥시게나제-2에 선택적인 저해제는 기존의 비스테로이드성 항염증제에 비해 작용기전에 의한 부작용이 없을 것으로 예상되고, 항염증, 진통, 해열 작용을 나타낼 것이 예상되며, 또한 호르몬에 의해 일어나는 자궁 수축의 저해와 몇몇 종류의 암 성장을 저해할 것으로 예상된다. 특히 위장 독성, 신장 독성 등의 부작용이 적을 것으로 예상된다. 또한 수축성 프로스타노이드의 합성을 방지하여 프로스타노이드에 의해 유발되는 평활근의 수축을 저해할 수

있을 것이며, 따라서 조산, 월경 불순, 천식 및 호산구에 연관된 질병에 유용할 것이 예상된다.

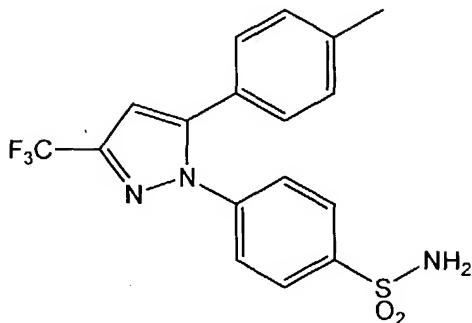
- <10> 최근에는 이러한 비스테로이드성 항염증제들이 대장암(European Journal of Cancer, Vol 37, p2302, 2001), 전립선암(Urology, Vol 58, p127, 2001)이나 치매(Exp.Opin.Invest.Drugs, Vol 9, p671, 2000)등에도 효과가 있다는 것이 발표됨에 따라 본 발명에 따른 신규화합물들도 이러한 적응증에도 효과가 있을 것으로 예상된다.
- <11> 그 외에도 골다공증 또는 녹내장의 치료에도 유용할 것이 예상되는데, 사이클로옥시게나제-2 에 선택적인 저해제의 유용성에 대해서는 문헌(참조: John Vane, Towards a better aspirin" in *Nature*, Vol.367, pp215-216, 1994; Bruno Battistini, Regina Botting and Y.S. Bakhle, "COX-1 and COX-2: Toward the Development of More Selective NSAIDs" in *Drug News and Perspectives*, Vol. 7, pp501-512, 1994; David B. Reitz and Karen Seibert, "Selective Cyclooxygenase Inhibitors" in *Annual Reports in Medicinal Chemistry*, James A. Bristol, Editor, Vol. 30, pp179-188, 1995)에 잘 기술되어 있다.
- <12> 사이클로옥시게나제-2에 선택적으로 작용하는 저해제로서 공지된 기존의 약물들은 그 구조에 있어서 매우 다양한 형태를 취하고 있다. 그 중 가장 일반적으로

연구되고 따라서 가장 많은 후보물질이 설계된 구조는 디아릴 헤테로사이클의 구조, 즉 트리사이클릭 시스템으로서 이 구조는 특징적으로 하나의 페닐에 술폰아미드 혹은 메틸 술폰기가 필수적으로 존재한다. 이러한 구조의 초기 물질은 Dup697 (Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, Vol 5, p2123, 1995)이며, 이 후 그의 유도체로서 피라졸 구조를 가지는 SC-58635(Journal of Medicinal Chemistry, Vol 40, p1347, 1997), 퓨란 온 구조를 가지는 MK-966(WO 95/00501) 등이 발표되었다.

<13> 미국특허번호 5,466,823에 따르면 하기 화학식 58의 화합물(셀레콕시브)를 게시하고 있다. 하기 셀레콕시브는 치환된 피라졸 벤젠 술폰아미드 유도체이다.

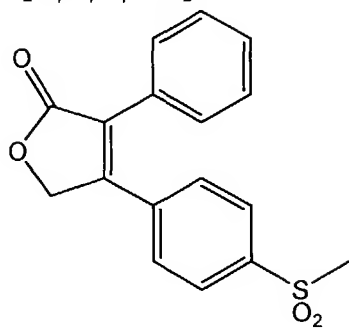
<14> [화학식 58]

<15>



<16> WO 95/00501에 따르면, 하기 화학식 59를 갖는 화합물(로페콕시브)을 게시하고 있다. 로페콕시브는 상기 셀레콕시브와 같이 헤테로사이클 구조지만 헤테로고리로서 퓨란 온 구조를 갖는다.

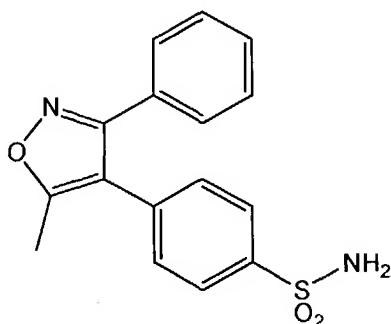
## &lt;17&gt; 【화학식 59】



<18> 미국특허번호 5,633,272에서는 하기 화학식 60과 같은 화합물(발데콕시브)을 기재하고 있다. 발데콕시브는 로페콕시브와 같이 메탄술포닐 벤젠구조를 갖지만 헤테로고리로서 옥사졸 구조를 갖는다.

## &lt;19&gt; [화학식 60]

&lt;20&gt;



<21> 상기 화학식 58 내지 60의 화합물은 모두 사이클로옥시게나제-2에 대한 선택적 억제제로서 기존의 비스테로이드성 항염증제에 비해 부작용이 없는 소염진통치료 효과를 갖는다.

## 【발명이 이루고자 하는 기술적 과제】

<22> 이에 본 발명자들은 사이클로옥시게나제-2의 저해제로서 선택성이 뛰어난 신규 화합물들을 개발하고자 지속적인 연구를 수행하였으며, 그 결과 상기 종래 화합물의 특징적인 구조 중 하나인 메틸술포닐 구조 또는 술포아미드 구조 포함하지만 1,2,4-트리아졸을 갖는

유도체가 시클로옥시게나제-2에 대하여 우수한 선택적 억제효과를 갖고 있음을 발견하여 본 발명을 완성하기에 이르렀다.

<23> 따라서, 본 발명은 화학식 1의 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염을 제공하는 것을 목적으로 한다.

<24> 또한 본 발명의 목적은 상기 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염의 제조방법을 제공하는 것을 포함한다.

<25> 또한 본 발명의 목적은 상기 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염을 유효성분으로 포함하는 해열, 진통, 소염 효과를 갖는 약제학적 조성물을 제공하는 것을 포함한다.

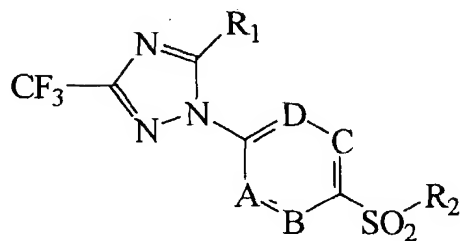
<26> 또한 본 발명의 목적은 상기 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염을 유효성분으로 포함하는 암 치료용 또는 치매 치료용 약제학적 조성물을 제공하는 것을 포함한다.

### 【발명의 구성 및 작용】

<27> 본 발명은 하기 화학식 1로 표시되는 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염에 관한 것이다.

<28> [화학식 1]

<29>



<30> 상기 화학식 1에서,

- <31>  $R_1$ 은  $C_3 - C_6$  시클로알킬;  $C_3 - C_6$  시클로알케닐; 페닐;  $C_1 - C_6$  알킬,  $C_1 - C_6$  할로알킬,  $C_1 - C_6$  알콕시,  $C_1 - C_6$  할로알콕시, 할로젠, 아미노, 모노알킬아미노, 디알킬아미노, 니트로, 및 시아노로 이루어진 군으로부터 선택된 기로 하나 이상 치환된 페닐; 스티레닐;  $C_1 - C_6$  알콕시 스티레닐; 피리딜이고,
- <32>  $R_2$ 는 메틸 또는 아미노이고,
- <33> A,B,C, 및 D는 각각 독립적으로 탄소 또는 질소를 나타낸다.
- <34> 상기 화학식 1로 표시되는 화합물은 무독성 염의 형태로 존재할 수 있다. 여기서 무독성 염이란 유기염과 무기염을 포함하는 약제학적으로 허용되는 비독성염을 의미한다.
- <35> 상기 화학식 1의 화합물과의 무기염에는 알루미늄, 암모늄, 칼슘, 구리, 철, 리튬, 마그네슘, 망간, 칼륨, 나트륨, 또는 아연과의 염이 있으나 이에 한정되지 않으며, 암모늄, 칼슘, 마그네슘, 칼륨, 또는 나트륨염이 바람직하다.
- <36> 상기 화학식 1의 화합물과의 유기염에는 1급, 2급 또는 3급 아민, 자연에 존재하는 치환된 아민, 사이클릭아민, 또는 염기성 이온 교환 수지와와의 염이 있어 있으나 이에 한정되지는 않는다. 염기성 이온 교환 수지 등으로부터 준비된 염들의 예에는 아르기닌, 베타인, 카페인, 콜린, N,N-디벤질에틸렌디아민, 디에틸아민, 2-디에틸아미노에탄올, 2-디메틸아미노에탄올, 에탄올아민, 에틸렌디아민, N-에틸모폴린, N-에틸피페리딘, N-메틸글루카민, 글루카민, 글루코사민, 히스티딘, 히드라민, N-(2-하이드록시에틸)피페리딘, N-(2-하이드록시에틸)피롤리딘, 이소프로필아민, 라이신, 메틸글루카민, 모폴린, 피페라진, 피페리딘, 폴리아민 수지, 프로카인, 퓨린,

테오브로민, 트리에틸아민, 트리메틸아민, 트리프로필아민, 트로메타민 등의 염이 있으나 이에 한정되지는 않는다.

<37> 상기 화학식 1의 화합물은 약제학적으로 허용되는 유기산 또는 무기산과의 염의 형태로 존재할 수 있다.

<38> 상기 화학식 1의 화합물의 유기산염 또는 무기산염에는 아세트산, 아디프산, 아스파르트산, 1,5-나프탈렌디술폰산, 벤젠술폰산, 벤조산, 캄포술폰산, 시트르산, 1,2-에탄디술폰산, 에탄술폰산, 에틸렌디아민테트라아세트산, 푸마르산, 글루코헵톤산, 글루콘산, 글루탐산, 요오드화수소산, 브롬화수소산, 염산, 이세티온산, 락트산, 말레산, 말산, 만데르산, 메탄술폰산, 묽식산, 2-나프탈렌디술폰산, 니트르산, 옥살산, 파르노산, 펜토텐산, 인산, 피발릭산, 프로피온산, 살리실산, 스테아르산, 숙신산, 황산, 타타르산, p-톨루엔술폰산, 운데카노산, 또는 10-운데케노산과의 염이 있으나 이에 한정되지는 않으며, 숙신산, 브롬화수소산, 염산, 말레산, 메탄술폰산, 인산, 황산, 또는 타타르산과의 염이 바람직하다.

<39> 본 발명의 1,2,4-트리아졸 유도체에는

<40> 1-(4-메탄술폰닐-페닐)-5-페닐-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

<41> 5-(4-브로모-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

<42> 5-(3-브로모페닐)-1-(4-메탄술폰닐페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

<43> 5-(4-플루오로-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

<44> 5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]

트리아졸;

- <45> 5-(4-클로로-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <46> 5-(3,4-디클로로-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <47> 5-(3,4-디메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <48> 5-(3,4-디플루오로-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아  
졸;
- <49> 1-(4-메탄술폰닐-페닐)-5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <50> 5-(3,4-디메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <51> 1-(4-메탄술폰닐-페닐)-5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <52> 5-(3,4-디메틸-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <53> 5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아  
졸;
- <54> 5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아  
졸;
- <55> 5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리  
아졸;
- <56> 5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리  
아졸;
- <57> 5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리  
아졸;



- <58> 5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <59> 5-(3-플루오로-4-메톡시-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <60> 1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메틸-페닐)-1H[1,2,4]트리아졸;
- <61> 5-(4-에톡시-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <62> 1-(4-메탄술포닐-페닐)-5-(4-트리플루오로메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <63> 5-(4-*t*-부틸-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <64> 5-(4-시아노-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <65> 5-[4-(N-메틸아미노)-페닐]-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <66> 5-[4-(N,N-디메틸아미노)-페닐]-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <67> 5-(4-아미노-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <68> 5-(3-트리플루오로메틸-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <69> 5-(3-메톡시-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <70> 1-(4-메탄술포닐-페닐)-5-*m*-톨릴-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

- <71> 1-(4-메탄술포닐-페닐)-5-o-톨릴-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <72> 5-(2-브로모-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <73> 5-(2-메톡시-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <74> 5-(2,4-디플루오로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아  
졸;
- <75> 5-(2,5-디플루오로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아  
졸;
- <76> 5-(2,4,5-트리플루오로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트  
리아졸;
- <77> 5-(2,3-디클로로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <78> 5-(2,4-디클로로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <79> 5-(3,5-디플루오로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아  
졸;
- <80> 5-(3,5-디메톡시-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <81> 5-(2,4-디메톡시-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;
- <82> 5-(3,4,5-트리메톡시-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리  
아졸;
- <83> 5-(2-플루오로-4-트리플루오로메틸-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H  
-[1,2,4]트리아졸;

- <84> 5-(2-클로로-4-니트로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;
- <85> 5-(2,4-디클로로-5-플루오로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;
- <86> 5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;
- <87> 5-벤조[1,3]디옥솔-5-일-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;  
;
- <88> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <89> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-에톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <90> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <91> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-*t*-부틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <92> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-시아노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <93> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <94> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-N-메틸아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <95> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-N,N-디메틸아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

- <96> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3-메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <97> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <98> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3-메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <99> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <100> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,5-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <101> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4,5-트리플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <102> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,3-디클로로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <103> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디클로로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <104> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3,5-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <105> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3,5-디메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <106> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

- <107> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3,4,5-트리플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <108> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2-플루오로-4-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <109> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2-클로로-4-니트로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <110> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디클로로-5-플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <111> 5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <112> 2-(5-벤조[1,3]디옥솔-5-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-5-메탄술포닐-피리딘;
- <113> 3-[2-(4-메탄술포닐-페닐)-5-트리플루오로메틸-2H-[1,2,4]트리아졸-3-일]-피리딘;
- <114> 4-[2-(4-메탄술포닐-페닐)-5-트리플루오로메틸-2H-[1,2,4]트리아졸-3-일]-피리딘;
- <115> 5-시클로헥실-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;
- <116> 5-시클로헥센-1-일-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;
- <117> 4-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술포나미드;
- <118> 4-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술포나미드;
- <119> 4-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술포나미드;

- <120> 4-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드 ;
- <121> 4-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드 ;
- <122> 4-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드 ;
- <123> 4-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드 ;
- <124> 4-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드 ;
- <125> 4-(5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드 ;
- <126> 4-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드 ;
- <127> 4-[5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드 ;
- <128> 4-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드 ;
- <129> 4-[5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드 ;
- <130> 4-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드 ;
- <131> 4-[5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드 ;
- <132> 4-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드 ;

- <133> 4-[5-(3-플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <134> 4-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <135> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <136> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(4-에톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <137> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <138> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(4-*t*-부틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <139> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(4-시아노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <140> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(4-아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <141> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(4-N-메틸아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- ;
- <142> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(4-N,N-디메틸아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <143> 4-[3-트리플루오로메틸-5-*m*-톨릴-1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <144> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(3-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <145> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(3-메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

- <146> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(2-브로모-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <147> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(2-메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <148> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드  
;
- <149> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(2,5-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드  
;
- <150> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4,5-트리플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아  
미드;
- <151> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(2,3-디클로로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <152> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디클로로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <153> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(3,5-디메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <154> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <155> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(3,4,5-트리플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아  
미드;
- <156> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(2-플루오로-4-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]  
-벤젠술폰아미드;
- <157> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(2-클로로-4-니트로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아  
미드;
- <158> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디클로로-5-플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠  
술폰아미드;



- <159> 4-[3-트리플루오로메틸-5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;
- <160> 4-(5-벤조[1,3]디옥솔-5-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드;
- <161> 4-(5-피리딘-3-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드;
- <162> 4-(5-피리딘-4-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드;
- <163> 4-(5-시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드;
- <164> 4-(5-시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드;
- <165> 5-메탄술폰닐-2-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘;
- <166> 2-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;
- <167> 2-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;
- <168> 2-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;
- <169> 2-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;
- <170> 2-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;
- <171> 5-메탄술폰닐-2-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;
- <172> 2-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;
- <173> 5-메탄술폰닐-2-(5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘;

<174> 2-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리딘;

<175> 2-[5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리딘;

<176> 2-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리딘;

<177> 6-[5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

<178> 6-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

<179> 6-[5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

<180> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

<181> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-에톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

<182> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

<183> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-*t*-부틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

<184> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-시아노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<185> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<186> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-N-메틸아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<187> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-N,N-디메틸아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<188> 6-[3-트리플루오로메틸-5-*m*-톨릴-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<189> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(3-메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<190> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(3-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<191> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(2-브로모-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<192> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(2-메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<193> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

- <194> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(2,5-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;
- <195> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(3,5-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;
- <196> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4,5-트리플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;
- <197> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(2-플루오로-4-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;
- <198> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;
- <199> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(3,4,5-트리메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;
- <200> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(2-클로로-4-니트로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;
- <201> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디플루오로-5-플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;
- <202> 6-[3-트리플루오로메틸-5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;
- <203> 2-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;

- <204> 2-[5-(3-플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰  
포닐-피리딘;
- <205> 2-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄  
술폰-피리딘;
- <206> 5-메탄술폰-2-((3-피리디닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일))-피리딘;
- <207> 5-메탄술폰-2-((4-피리디닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일))-피리딘;
- <208> 2-(5-시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-5-메탄술폰-피리딘;
- <209> 2-(5-시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-5-메탄술폰-피리딘;
- <210> 6-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-3-술폰산 아마이드;
- <211> 6-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미  
드;
- <212> 6-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아  
미드;
- <213> 6-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰  
산 아마이드;
- <214> 6-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미  
드;
- <215> 6-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산  
아미드;

<216> 6-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<217> 6-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<218> 6-(5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-3-술폰산 아미드;

<219> 6-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<220> 6-[5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<221> 6-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<222> 6-[5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<223> 6-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<224> 6-[5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

<225> 6-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

- <226> 6-[5-(3-플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-  
술폰산 아미드;
- <227> 6-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘  
-3-술폰산 아미드;
- <228> 6-(5-피리딘-3-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-3-술폰산 아미드;
- <229> 6-(5-피리딘-4-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-3-술폰산 아미드;
- <230> 6-(5-시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-3-술폰산 아미드;
- <231> 6-(5-시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-3-술폰산 아미  
드;
- <232> 2-메탄술폰닐-5-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘;
- <233> 5-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술폰닐-피리딘;
- <234> 5-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술폰닐-피리  
딘;
- <235> 5-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술폰닐-  
피리딘;
- <236> 5-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술폰닐-피리딘;
- <237> 5-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술폰닐-피  
리딘;
- <238> 2-메탄술폰닐-5-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

<239> 5-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술포닐-피리딘;

<240> 2-메탄술포닐-5-(5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘;

<241> 5-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술포닐-피리딘;

<242> 5-[5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술포닐-피리딘;

<243> 5-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술포닐-피리딘;

<244> 5-[5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아마이드;

<245> 5-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아마이드;

<246> 5-[5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아마이드;

<247> 5-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술포닐-피리딘;

<248> 5-[5-(3-플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술포닐-피리딘;



- <249> 5-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄  
술포닐-피리딘;
- <250> 5-(5-시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-2-메탄술포닐-피리딘;
- <251> 5-(5-시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-2-메탄술포닐-피리딘;
- <252> 5-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-2-술포산 아마이드;
- <253> 5-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산 아미  
드;
- <254> 5-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산 아  
미드;
- <255> 5-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포  
산 아마이드;
- <256> 5-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산 아미  
드;
- <257> 5-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산  
아미드;
- <258> 5-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산 아미  
드;
- <259> 5-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산  
아미드;
- <260> 5-(5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-2-술포산 아마이드;

- <261> 5-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;
- <262> 5-[5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;
- <263> 5-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;
- <264> 5-[5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;
- <265> 5-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;
- <266> 5-[5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;
- <267> 5-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;
- <268> 5-[5-(3-플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;
- <269> 5-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;
- <270> 5-(5-피리딘-3-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-2-술폰산 아미드;
- <271> 5-(5-피리딘-4-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-2-술폰산 아미드;

- <272> 5-(5-시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-2-술폰산 아미드;
- <273> 5-(5-시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-2-술폰산 아미드;
- <274> 3-메탄술폰닐-6-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진;
- <275> 3-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술폰닐-피리다진;
- <276> 3-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술폰닐-피리다진;
- <277> 3-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술폰닐-피리다진;
- <278> 3-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술폰닐-피리다진;
- <279> 3-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술폰닐-피리다진;
- <280> 3-메탄술폰닐-6-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진;
- <281> 3-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술폰닐-피리다진;
- <282> 3-메탄술폰닐-6-(5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진;

- <283> 3-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;
- <284> 3-[5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;
- <285> 3-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;
- <286> 3-[5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;
- <287> 3-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;
- <288> 3-[5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;
- <289> 3-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;
- <290> 3-[5-(3-플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;
- <291> 3-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;
- <292> 3-메탄술포닐-6-(5-피리딘-3-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진;
- <293> 3-메탄술포닐-6-(5-피리딘-4-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진;

- <294> 3-(5-시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-6-메탄술포닐-피리다진;
- <295> 3-(5-시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-6-메탄술포닐-피리다진;
- <296> 6-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진-3-술포산 아마이드;
- <297> 6-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;
- <298> 6-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;
- <299> 6-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;
- <300> 6-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;
- <301> 6-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;
- <302> 6-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;
- <303> 6-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;
- <304> 6-(5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진-3-술포산 아마이드;

- <305> 6-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술폰산  
아미드;
- <306> 6-[5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술폰산  
아미드;
- <307> 6-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술폰산  
아미드;
- <308> 6-[5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-  
술폰산 아미드;
- <309> 6-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-  
술폰산 아미드;
- <310> 6-[5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-  
술폰산 아미드;
- <311> 6-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-  
술폰산 아미드;
- <312> 6-[5-(3-플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진  
-3-술폰산 아미드;
- <313> 6-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다  
진-3-술폰산 아미드;
- <314> 6-(5-피리딘-3-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진-3-술폰산  
아미드;

- <315> 6-(5-피리딘-4-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진-3-술폰산 아미드 ;
- <316> 6-(5-시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진-3-술폰산 아미드 ;
- <317> 6-(5-시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진-3-술폰산 아미드 ;
- <318> 5-메탄술폰닐-2-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리미딘 ;
- <319> 2-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리미딘 ;
- <320> 2-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리미딘 ;
- <321> 2-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리미딘 ;
- <322> 2-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리미딘 ;
- <323> 2-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리미딘 ;
- <324> 5-메탄술폰닐-2-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘 ;
- <325> 2-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리미딘 ;

<326> 5-메탄술포닐-2-(5-*p*-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리미딘;

<327> 2-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리미딘;

<328> 2-[5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리미딘;

<329> 2-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리미딘;

<330> 2-[5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리미딘;

<331> 2-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리미딘;

<332> 2-[5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리미딘;

<333> 2-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리미딘-5-술폰산 아마이드;

<334> 2-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아마이드;

<335> 2-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아마이드;

<336> 2-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아마이드;



- <337> 2-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아미드;
- <338> 2-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아미드;
- <339> 2-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아미드;
- <340> 2-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아미드;
- <341> 2-(5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리미딘-5-술폰산 아미드;
- <342> 2-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아미드;
- <343> 2-[5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아미드;
- <344> 2-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아미드;
- <345> 2-[5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아미드;
- <346> 2-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아미드;

<347> 2-[5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-  
술폰산 아마이드;

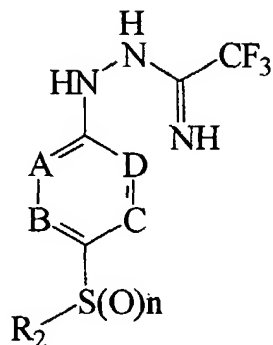
<348> 5-스티릴-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸; 및

<349> 5-[2-(4-메톡시페닐)-비닐]-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]  
트리아졸로 구성된 그룹에서 선택된 어느 하나인 것이 바람직하다.

<350> 본 발명은 상기 화학식 1의 1,2,4-트리아졸 유도체의 합성중간체로서 하기 화학식 4 의  
아미드라존 유도체를 제공한다.

<351> [화학식 4]

<352>

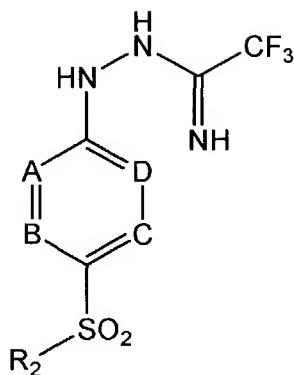


<353> 상기에서, R<sub>2</sub>, A, B, C, 및 D는 화학식 1에서 정의한 바와 같고, n은 0 내지 2의  
정수이다.

<354> 또한 본 발명은 화학식 4a의 아미드라존 유도체와 화학식 5의 아실클로라이드를 염기 존  
재하에서 반응시키는 단계를 포함하는 화학식 1의 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무  
독성 염의 제조방법을 제공한다.

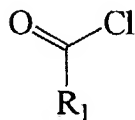
<355> [화학식 4a]

&lt;356&gt;



&lt;357&gt; [화학식 5]

&lt;358&gt;

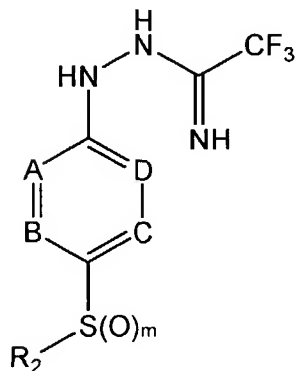


<359> 상기에서,  $R_1$ ,  $R_2$ , A, B, C, 및 D는 화학식 1에서 정의한 바와 같다.

<360> 본 발명은 또한 화학식 4b의 아미드라존 유도체와 화학식 5의 아실클로라이드를 염기 존재하에서 반응시키고, MMPP (Magnesium monoperoxyphthalate hexahydrate), MCPBA(m-chloroperoxybenzoic acid), 및 Oxone (Potassium peroxymonosulfate)로 구성된 군으로부터 선택된 산화제로 산화시키는 단계를 포함하는 화학식 1의 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염의 제조방법을 제공한다.

&lt;361&gt; [화학식 4b]

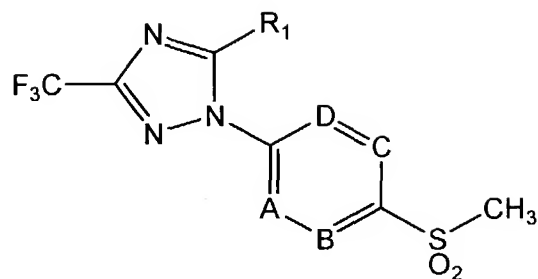
&lt;362&gt;



- <363> 상기에서,  $R_2$ , A, B, C, 및 D는 화학식 1에서 정의한 바와 같고 m은 0 또는 1이다.
- <364> 상기 트리아졸의 형성반응의 용매로는 극성용매가 바람직하며, 그러한 극성용매로는 디메틸포름아미드, 디옥산, 디메틸설폭사이드, 메틸피롤리디논, 또는 *m*-크실렌이 있으나 이에 한정되지는 않는다.
- <365> 반응온도는  $-10^{\circ}\text{C}$  내지  $110^{\circ}\text{C}$ 에서 수행하는 것이 바람직하며, 반응시간은 기질에 따라 10분 내지 36시간이 필요하다.
- <366> 반응이 완료되면 물과 에틸아세테이트, 디클로로메탄, 테트라하이드로퓨란, 또는 에테르 등의 유기용매를 이용한 추출을 통해 염들을 제거한 후 실리카겔 상에서 컬럼크로마토그래피로 정제하여 생성물을 획득하는 것이 바람직하다.
- <367> 이때 사용되는 염기로는 유기염기 또는 무기염기가 있으며, 유기염기로는 트리에틸아민, 트리메틸아민, 트리프로필아민, 피리딘, 또는 이미다졸이 바람직하며, 무기염기로는 나트륨아세테이트, 수산화나트륨, 수소화나트륨, 수산화칼륨, 탄산나트륨, 또는 탄산칼륨이 바람직하고, 이중에서도 피리딘이 가장 바람직하다.
- <368> 상기 설폰기를 산화시키는 반응은 디클로로메탄 중에서 산화제를 사용하여 수행하는 것이 바람직하며, 산화제로는 MMPP(Magnesium monoperoxyphthalate hexahydrate), MCPBA(*m*-chloroperoxybenzoic acid), 또는 Oxone(Potassium peroxymonosulfate) 등을 사용하는 것이 바람직하다.
- <369> 본 발명은 화학식 1a의 화합물과 히드록시아민 또는 그의 염을 강염기 및 루이스산의 존재하에서 반응시키는 단계를 포함하는 것을 특징으로 하는 화학식 1b의 화합물의 제조방법을 제공한다.

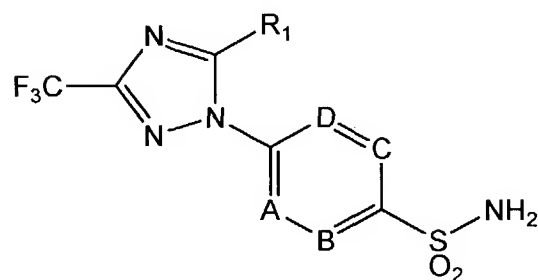
<370> [화학식 1a]

<371>



<372> [화학식 1b]

<373>

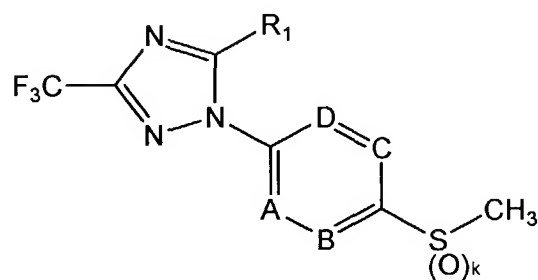


<374> 상기에서, R<sub>1</sub>, A, B, C, 및 D은 화학식 1에서 정의한 바와 같다.

<375> 본 발명은 또한 화학식 6a의 화합물과 히드록시아민 또는 그의 염을 강염기 및 루이스산의 존재하에서 반응시키고, MMPP (Magnesium monoperoxyphthalate hexahydrate), MCPBA(m-chloroperoxybenzoic acid), 및 Oxone (Potassium peroxymonosulfate)로 구성된 군으로부터 선택된 산화제로 산화시키는 단계를 포함하는 화학식 1b의 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염의 제조방법을 제공한다.

<376> [화학식 6a]

<377>



<378> 상기에서,  $R_1$ , A, B, C, 및 D는 화학식 1에서 정의한 바와 같고 k는 1 또는 0이다.

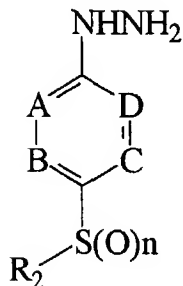
<379> 상기 히드록시아민의 염에는 황산염, 염산염, 인산염, 질산염, 또는 술폰산염이 바람직하다.

<380> 상기  $R_2$ 가 아미노기인 화합물을 얻는 반응은 테트라하이드로퓨란, 에테르 등을 용매로 하여 여러가지 알킬리튬, 아릴리튬, 알킬마그네슘클로라이드, 또는 아릴 마그네슘클로라이드 등 강염기하에서  $-78^{\circ}\text{C}$  내지  $80^{\circ}\text{C}$ 의 온도로 탈수소반응을 진행한 후 여러가지 알킬보론, 아릴보론, 알킬알루미늄, 또는 아릴알루미늄 등의 루이스산과  $-78^{\circ}\text{C}$ ~ $80^{\circ}\text{C}$ 의 온도에서 반응시킨다. 이후 히드록시아민 황산염을 사용하여 아민화반응을 수행한다. 여러가지 아민화 화합물중 히드록시아민 황산염은 과량 사용시 부반응이 적고 남은 양 및 부반응물은 추출을 통하면 물층으로 빠져나가므로 제거가 쉬워 사용이 유용하다. 이 후 컬럼크로마토그래피로 정제하여 원하는 설포아미드기를 갖는 생성물을 얻는다.

<381> 본 발명은 또한 화학식 2의 히드라진 유도체와 화학식 3의 트리플루오로아세트이미딘을 염기의 존재하에서 반응시키는 단계를 포함하는 화학식 4의 화합물의 제조방법을 제공한다.

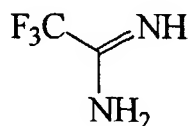
<382> [화학식 2]

<383>



<384> [화학식 3]

&lt;385&gt;



<386> 상기에서, R<sub>2</sub>, A, B, C, D, 및 n은 화학식 4에서 정의한 바와 같다.

<387> 상기 제조방법에 있어서, 트리플루오로아세트이미딘과 아릴 히드라진 또는 헤테로 아릴 히드라진과의 반응은 염기 존재 하에 의해 이루어지며, 용매로는 메탄올 또는 메탄올과 테트라하이드로퓨란의 혼합용매를 사용하는 것이 바람직하다.

<388> 반응온도는 -10℃ 내지 66℃ 에서 수행하는 것이 바람직하며, 반응시간은 기질에 따라 10분에서 길게는 48시간이 필요하다.

<389> 반응이 완료되면 물과 에틸 아세테이트, 디클로로메탄, 테트라하이드로퓨란, 또는 에테르 등의 유기용매를 이용한 추출을 통해 염들을 제거한 후 실리카겔 상에서 컬럼크로마토그래피로 정제하여 생성물을 획득하는 것이 바람직하다.

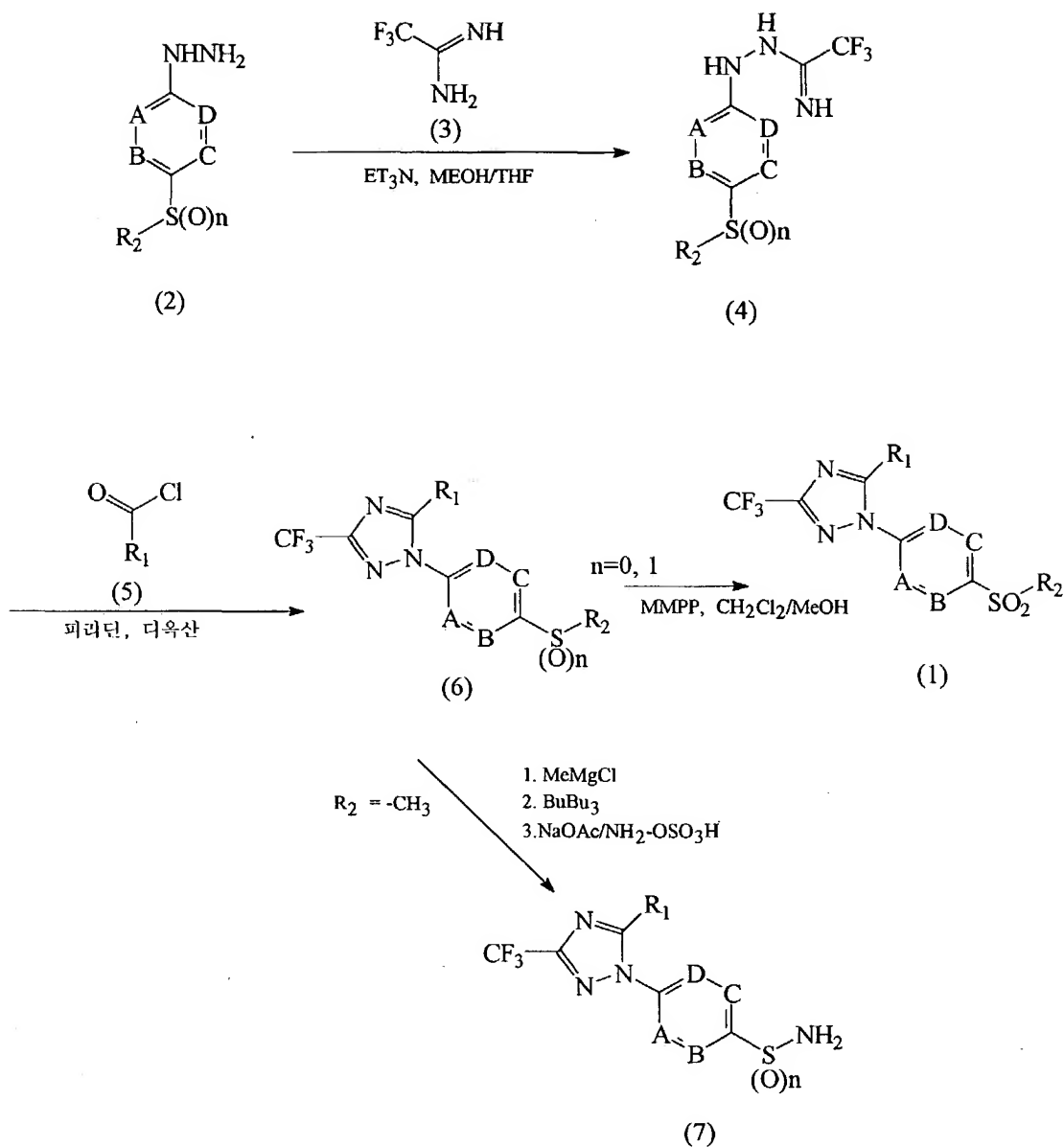
<390> 이때 사용되는 염기로는 유기염기 또는 무기염기가 있으며, 유기염기로는 트리에틸아민, 트리메틸아민, 트리프로필아민, 피리딘, 또는 이미다졸이 바람직하며, 무기염기로는 나트륨아세테이트, 수산화나트륨, 수소화나트륨, 수산화칼륨, 탄산나트륨, 또는 탄산칼륨이 바람직하고, 이중에서도 트리에틸아민이 가장 바람직하다.

<391> 상기 모든 반응이 완결된 후의 생성물은 통상적인 후처리 방법, 예를 들면 크로마토그래피, 재결정화 등의 방법에 의해 분리 및 정제할 수 있다.

<392> 상기에서 설명한 화학식 1의 제조방법을 연속적으로 표현하면 다음과 같다.

<393> [반응식1]

&lt;394&gt;



<395> 상기 반응식 1에서,  $\text{R}_1$ ,  $\text{R}_2$ , A, B, C, D, 및 n은 앞서 정의한 바와 같다.

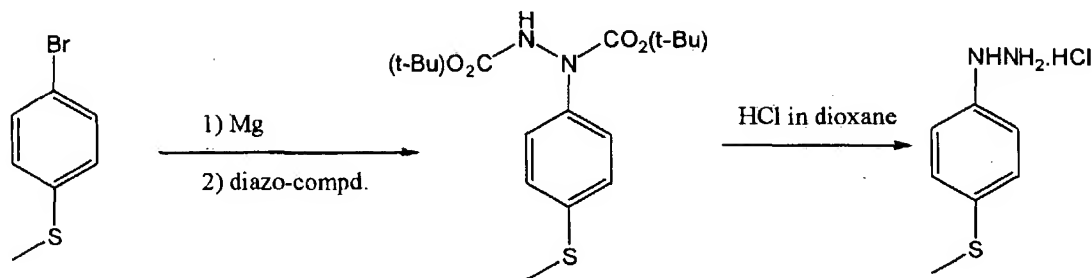
<396> 위에 사용된 여러가지 히드라진 유도체중 4-히드라진노벤젠술폰아미드 염산염은 Maybridge사를 통해 구입하여 사용하였고, 그 이외의 히드라진 유도체는 그 자체로 또는 염산염의 형태로 공지된 방법에 의해 합성하여 사용하였다 (Tetrahedron Letters, vol 28, No 42, p4933, 1987 / USP 4,204,870 / The Journal of Organic Chemistry, vol 56,



No 16, p4974, 1991 / EP 1104759 / Tetrahedron, vol 48, No 21, p6791, 1989). 이 중 대표적인 몇가지 히드라진 유도체에 대한 합성법을 하기 반응식 2 내지 반응식5로 나타내었다.

<397> [반응식 2]

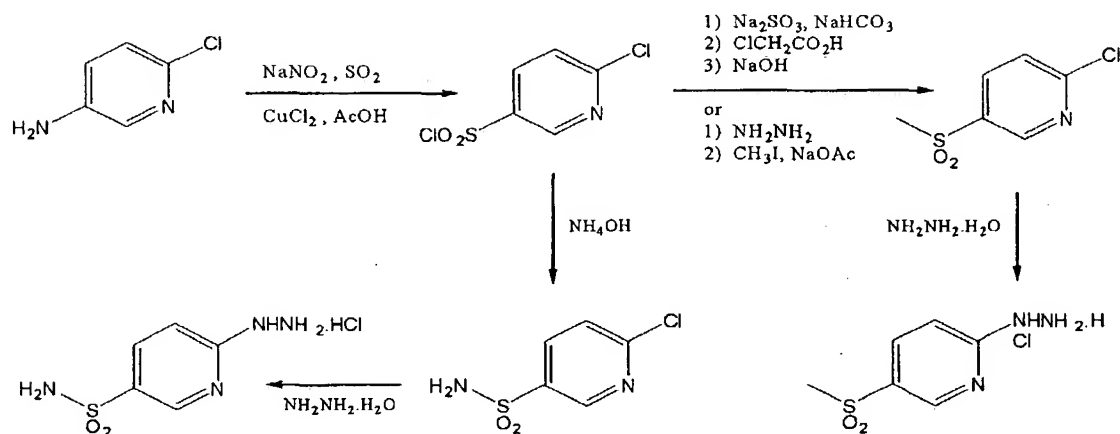
<398>



<399> 4-브로모 티오아니솔을 마그네슘으로 반응시켜 그리나드(Grignard) 화합물을 제조하고, 이를 디아조화합물과 반응시킨 후 염화수소와 반응시켜 히드라진 유도체 산염을 얻는다.

<400> [반응식 3]

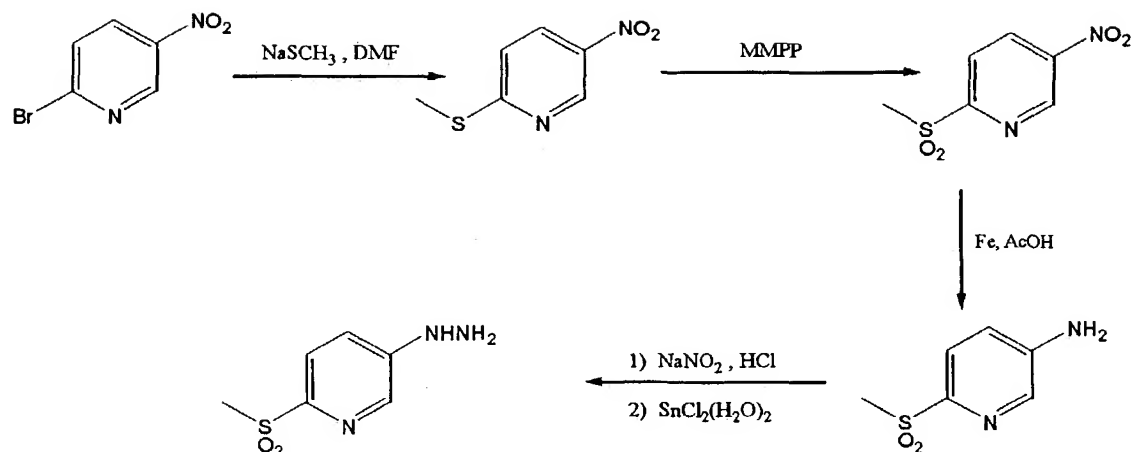
<401>



<402> 피리딘 유도체의 경우는 히드라진 일수화물을 직접 반응시켜 2-히드라지노피리딘 유도체를 얻는다.

&lt;403&gt; [반응식 4]

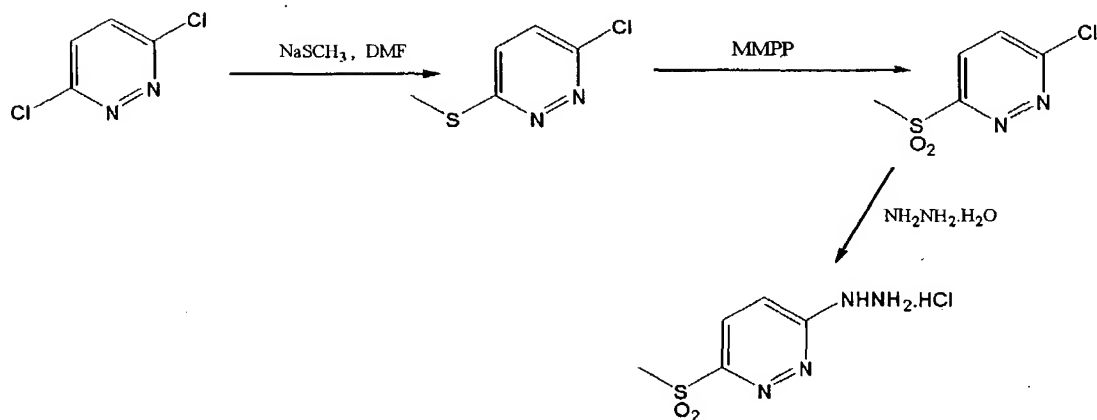
&lt;404&gt;



<405> 3-히드라지노피리딘 유도체는 니트로기를 아민기로 환원반응시킨 후 히드라진기를 도입하는 방법을 통해 얻을 수 있다.

&lt;406&gt; [반응식 5]

&lt;407&gt;



<408> 2-히드라지노피리다진 유도체는 상기 반응식 3의 피리딘 유도체의 경우를 응용하여 2,5-디클로로 피리다진으로부터 위와 같은 방법으로 얻을 수 있다.

<409> 본 발명에 따른 화합물의 제조방법, 예를들어 반응용매, 염기, 반응물질의 사용량과 같은 반응조건들이 하기에 설명된 것으로만 한정되는 것은 아니며, 본 명세서에 기재되거

나 당업계의 공지문헌에 게시된 여러 가지 합성방법을 임의로 조합함으로써 용이하게 제조할 수 있고 이러한 조합은 본 발명이 속하는 기술 분야의 당업자에게 범용화된 통상의 기술이다.

- <410> 본 발명은 치료학적으로 유효한 양의 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염을 유효성분으로 함유하고 약제학적으로 허용 가능한 담체를 포함하는 해열, 진통, 소염 효과를 갖는 약제학적 조성물을 제공한다.
- <411> 이러한 약제학적 조성물은 상기의 사이클로옥시게나제-2에 대한 선택적인 억제활성을 갖는 상기 화학식 1의 화합물 또는 그들의 약학적으로 허용 가능한 염을 포함하고 있으므로 부작용을 최소화한 해열, 진통, 소염제로서 사용할 수 있다.
- <412> 종래의 비스테로이드성 소염제는 병리학적 프로스타글란딘의 합성에 관여하는 시클로옥시게나제-2 뿐만 아니라 기본적인 내인성 프로스타글란딘의 분비에 관여하고 위장의 상태 유지 및 신장의 혈액순환 등 생리학적인 측면에서 중요한 역할을 하는 시클로옥시게나제-1까지 무차별적으로 억제하였기 때문에 여러가지 부작용을 가지고 있었다.
- <413> 이에 비하여, 상기 화학식 1의 화합물 및 그들의 약학적으로 허용 가능한 염은 사이클로옥시게나제-2에 선택적인 저해활성을 가지므로 시클로옥시게나제-1까지 무차별적으로 저해하는 종래의 비스테로이드성 해열, 진통, 소염제가 갖는 부작용을 최소화 할 수 있다.
- <414> 그러므로 화학식 1의 화합물 및/또는 그들의 약학적으로 허용 가능한 염과 약제학적으로 허용 가능한 담체 또는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물은 전형적인 비스테로이드성 항염증제의 대체약으로 쓰일 수 있으며, 특히 기존의 비스테로이드성 해열, 진통, 소염

제의 부작용이 개선된 대체 약물로서 소화성 궤양, 위염, 부분적인 장염, 궤양성 대장염, 게실염, 위장내 출혈, 저프로트롬빈 혈증 등이 있는 환자들에게 유용하다.

<415> 본 발명의 약제학적 조성물은 병리학적 프로스타글란딘 관련 염증질환 모두에 사용될 수 있으며, 특히 고용량의 투여를 요하는 골관절염, 류마티스 관절염에 유용하다.

<416> 상기 약제학적 조성물은 상기 활성성분인 화학식 1의 화합물 혹은 그들의 염을 기준으로 성인에게 50mg/kg 내지 400mg/kg 투여할 수 있으며, 질병의 심각정도에 따라 증감할 수 있다.

<417> 본 발명은 또한 치료학적으로 유효한 양의 제1항에 따른 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그 의 무독성 염을 유효성분으로 함유하고 약제적으로 허용 가능한 담체를 포함하는 암 치료용 약제적 조성물 및 치매 치료용 약제학적 조성물을 제공한다.

<418> 최근에 비스테로이드성 항염증제들이 대장암(European Journal of Cancer, Vol 37, p2302, 2001), 전립선암(Urology, Vol 58, p127, 2001)이나 치매 (Exp.Opin.Invest.Drugs, Vol 9, p671, 2000)등에도 효과가 있다는 것이 발표되었다. 이에 따라 비스테로이드성 항염증제인 상기 화학식 1의 화합물 또는 그들의 약학적으로 허용 가능한 염을 포함하는 약제학적 조성물은 대장암이나 치매 치료용 조성물로 사용할 수 있다.

<419> 상기 약제학적 조성물은 상기 활성성분인 화학식 1의 화합물 혹은 그들의 염을 기준으로 성인에게 50mg/kg 내지 400mg/kg 투여할 수 있으며, 질병의 심각정도에 따라 증감할 수 있다.

- <420> 상기 약제학적 조성물은 정제, 발포성 정제, 캡슐제, 과립제, 산제, 서방성 정제, 서방성 캡슐제(단독 및 복합 단위 제제), 정맥 내 및 근육 내 주사제의 형태로 및 주입액, 현탁액, 좌제의 형태로 또는 기타 적합한 약제학적 형태로 투여할 수 있다.
- <421> 서방성 약제학적 형태는 최초 투여 함유량을 갖거나 갖지 않는 완전하거나 부분적인 서방성 형태로 활성 화합물을 함유할 수 있다.
- <422> 활성 화합물은 함께 존재하거나, 부분적으로 또는 완전히 서로 분리된 제형으로서 존재하여, 개별 투여 또는 시간 단위로 단계화된 투여가 또한 가능할 수 있다.
- <423> 상기 완전히 분리된 제형이 존재하는 경우, 이들은 서로 협력하며, 이들이 배합된 혼합물내에서 존재할 수 있는 동일한 양 및 상응하는 중량비로 투여 단위내에 각각의 활성 화합물을 함유한다.
- <424> 지시된 배합물이 함유된 경구 투여가능한 약제학적 조성물이 바람직하다.
- <425> 상기 배합물을 함유하는 약제학적 제제를 제조하기 위해서, 활성 화합물은 생리학적으로 내성이 있는 부형제 및/또는 희석제 및/또는 보조제와 함께 바람직한 방식으로 지시된 양으로 제형화된다.
- <426> 부형제 및 보조제의 예는 젤라틴, 자당 또는 락토오스 같은 천연 당, 레시틴, 펙틴, 전분(예를 들면, 옥수수 전분 또는 아밀로오스), 사이클로덱스트린 및 사이클로덱스트린 유도체, 덱스트란, 폴리비닐피롤리돈, 폴리비닐 아세테이트, 아라비아 고무, 알긴산, 텔로오스, 활석, 리코포듐, 실리식산, 인산수소칼슘, 셀룰로오스, 메톡시프로필셀룰로오스 같은 셀룰로오스 유도체, 메틸셀룰로오스, 하이드록시프로필메틸셀룰로오스, 하이드록시프로필메틸셀룰로오스 프탈레이트, 탄소원자수 12 내지 22개의 지방산, 에멀션화제, 오

일 및 지방, 특히 또한 포화 지방산의 식물성 글리세롤 에스테르 및 폴리글리세롤 에스테르, 1가 또는 다가 알콜 및 폴리에틸렌 글리콜 같은 폴리글리콜, 탄소 원자 수 1 내지 20개의 1가 지방족 알콜, 또는 글리콜, 글리세롤, 디에틸렌 글리콜, 1,2-프로필렌 글리콜, 소르비톨, 만니콜 같은 다가 알콜을 갖는 탄소 원자 수 2 내지 22개의 지방족 포화 또는 불포화 지방산의 에스테르가 있다.

<427> 추가로 적합한 보조제는 또한 붕해를 야기하는 물질(소위 붕해제), 교차 결합된 폴리비닐피롤리돈, 카르복시메틸전분 나트륨, 카르복시메틸셀룰로오스 나트륨, 미세결정성 셀룰로오스가 있다. 공지된 피복 물질을 또한 사용할 수 있다. 아크릴산 및/또는 메타크릴산 및/또는 이의 에스테르의 중합체 및 공중합체, 제인(zein), 에틸셀룰로오스, 에틸셀룰로오스 석시네이트, 셀락 등이 있다.

<428> 피복 물질로서 적합한 가소제는 시트르산 에스테르 및 타르타르산 에스테르, 글리세롤 및 글리세롤 에스테르, 다양한쇄길이의 폴리에틸렌 글리콜이 있을 수 있다. 물 또는 생리학적으로 허용되는 유기 용매, 예를 들면, 알콜 및 지방 알콜이용액 또는 현탁액의 제조에 적합하다.

<429> 액체 제형에 있어서, 술포네이트 칼륨, 메틸 4-하이드록시벤조에이트 또는 프로필 4-하이드록시벤조에이트 같은 보존제, 아스코르브산 같은 항산화제 및 페퍼민트 오일 같은 방향 강화제를 사용할 필요가 있을 수 있다.

<430> 제제의 제조에 있어서, 폴리비닐피롤리돈 및 폴리술포네이트 80 같은 공지되고 통상적인 용해제, 또는 에멀션화제를 사용할 수 있다.

<431> 적합한 부형제 및 보조제의 추가적인 예는 문헌을 참조할 수 있다(Dr. H.P. Fiedler "

Lexikon der Hilfsstoffe für Pharmazie, Kosmetik und angrenzende Gebiete"

[Encyclopaedia of auxiliaries for pharmacy, cosmetics and related fields].

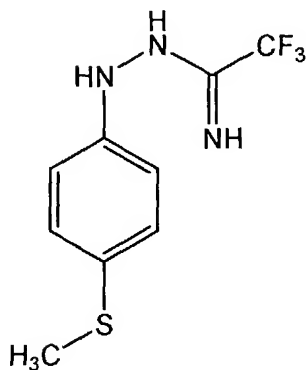
<432> 이하, 본 발명을 하기 실시예 및 실험예에 의해 더욱 구체적으로 설명한다. 그러나, 이들 실시예 및 실험예는 본 발명에 대한 이해를 돕기 위한 것일 뿐, 어떤 의미로든 본 발명의 범위가 이들에 의해 제한되는 것은 아니다.

<433> 실시예 1

<434> N-(4-메틸술팜닐-페닐)-트리플루오로아세트아미드라존

<435> [화학식 8]

<436>



<437> 4-메틸술팜닐페닐-히드라진 염산염 1.0g(5.24mmole)을 40ml의 메탄올과 테트라하이드로퓨란의 1:1혼합용매에 용해시킨 다음 트리에틸아민 0.80ml(5.76mmol)를 적가하였다. 반응액을 상온에서 30분간 교반 후 트리플루오로아세트이미딘 85% 0.90g(6.81mmol)을 적가하였다. 반응액을 상온에서 24시간 교반하였다. 반응이 종료된 후, 반응액에 물과 에틸아세테이트를 넣은 후 물층을 에틸아세테이트로 2회 추출한 다음 유기층을 포화 소금물로 1회 세척하고 무수 황산마그네슘으로 건조한 후 여과하였다. 감압여과로 얻어진

반응물을 속성 컬럼 크로마토그래피(에틸 아세테이트:노르말 헥산=2:8)로 정제하여 액체상의 표제화합물 0.88g(수율 67%)을 얻었다.

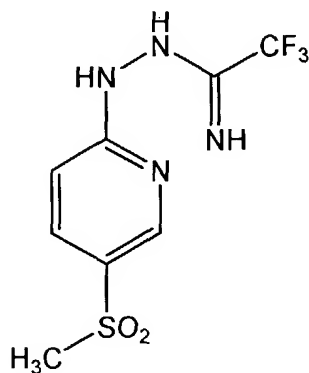
<438>  $^1\text{H-NMR}(400\text{MHz}, \text{CDCl}_3)$   $\delta$  2.55(s, 3H), 5.45(s, 2H, br), 7.40(d, 2H,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.60(d, 2H,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 9.70(s, 1H)

<439> 실시예 2

<440> N-(5-메틸술포닐-피리딘-2-일)-트리플루오로아세트아미드라존

<441> [화학식 9]

<442>



<443> 상기 실시예 1에서 4-메틸술포닐페닐-히드라진 염산염 대신에

5-메틸술포닐-피리딘-2-일 히드라진 염산염 300mg(1.34mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 1에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 205mg(수율 54%)을 수득하였다.

<444>  $^1\text{H-NMR}(400\text{MHz}, \text{CDCl}_3)$   $\delta$  2.90(s, 3H), 5.65(s, 2H, br), 6.95(dd, 1H,  $J_1=9.0\text{Hz}$ ,  $J_2=2.8\text{Hz}$ ), 7.80(dd, 1H,  $J_1=9.0\text{Hz}$ ,  $J_2=2.0\text{Hz}$ ), 9.70(d, 1H,  $J=2.8\text{Hz}$ ), 9.75(s, 1H)

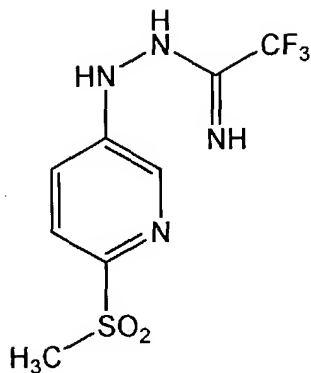
<445> 실시예 3

<446> N-(2-메틸술포닐-피리딘-5-일)-트리플루오로아세트아미드라존



<447> [화학식 10]

<448>



<449> 상기 실시예 1에서 4-메틸술파닐페닐-히드라진 염산염 대신에 2-메틸술포닐-피리딘-5-일 히드라진 염산염 300mg(1.34mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 1에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 194mg(수율 51%)을 수득하였다.

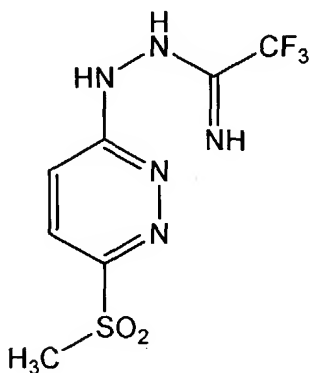
<450>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.35(s, 3H), 5.65(s, 2H, br), 6.95(dd, 1H,  $J_F=9.0\text{Hz}$ ,  $J_2=2.8\text{Hz}$ ), 7.80(dd, 1H,  $J_F=9.0\text{Hz}$ ,  $J_2=2.0\text{Hz}$ ), 9.70(d, 1H,  $J=2.8\text{Hz}$ ), 9.75(s, 1H)

<451> 실시예 4

<452> N-(6-메틸술포닐-피리다진-3-일)-트리플루오로아세트아미드라존

<453> [화학식 11]

<454>



<455> 상기 실시예 1에서 4-메틸술팜아닐페닐-히드라진 염산염 대신에 6-메틸술팜아닐-피리다진-3-일 히드라진 염산염 1.0g(4.45mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 1에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 0.8g(수율 64%)을 수득하였다.

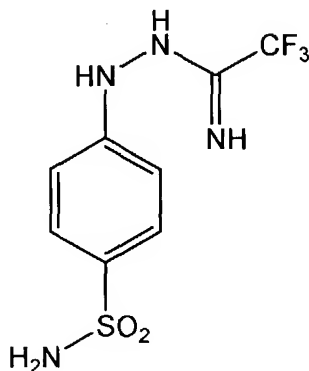
<456>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.45(s, 3H), 7.15(s, 2H, br), 7.45(d, 1H,  $J=9.5\text{Hz}$ ), 8.00(d, 1H,  $J=9.5\text{Hz}$ ), 10.80(s, 1H)

<457> 실시예 5

<458> N-(4-술팜아미도-페닐)-트리플루오로아세트아미드라존

<459> [화학식 12]

<460>



<461> 상기 실시예 1에서 4-메틸술팜아닐페닐-히드라진 염산염 대신에 4-히드라지노 벤젠술팜아미드 염산염 1.0g(4.47mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 1에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 0.9g(수율 68%)을 수득하였다.

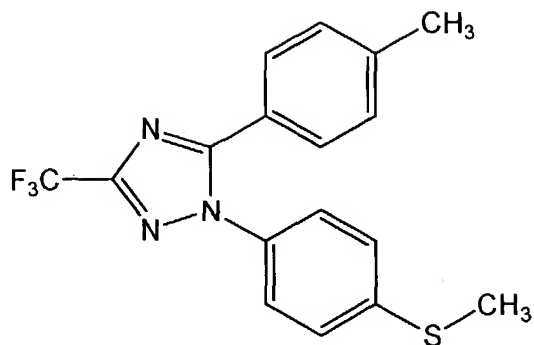
<462>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.15(s, 3H), 5.45(s, 2H, br), 7.31(s, 2H), 7.40(d, 2H,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.60(d, 2H,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 9.70(s, 1H)

<463> 실시예 6

<464> 1-(4-메틸술팜아닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

&lt;465&gt; [화학식 13]

&lt;466&gt;



<467> N-(4-메틸술파닐-페닐)-트리플루오로아세트아미드라존 220mg(0.88mmole)을 5ml의 1,4-디옥산에 용해시킨 다음 피리딘 0.08ml(0.97mmol)를 적가하였다. 반응액을 상온에서 10분간 교반 후 *p*-톨루오일 클로라이드 150mg(0.97mmol)을 적가하였다. 반응액을 끓는 점에서 24시간동안 환류시켜 교반하였다. 반응이 종료된 후, 반응액의 온도를 상온으로 내린 다음 반응액에 물과 에틸 아세테이트를 넣은 후 물층을 에틸 아세테이트로 2회 추출한 다음 유기층을 포화 소금물로 1회 세척하고 무수 황산마그네슘으로 건조한 후 여과하였다. 감압여과로 얻어진 반응물을 속성 컬럼 크로마토그래피(에틸 아세테이트:노르말 헥산=2:8)로 정제하여 오일상의 표제화합물 210mg(수율 65%)을 얻었다.

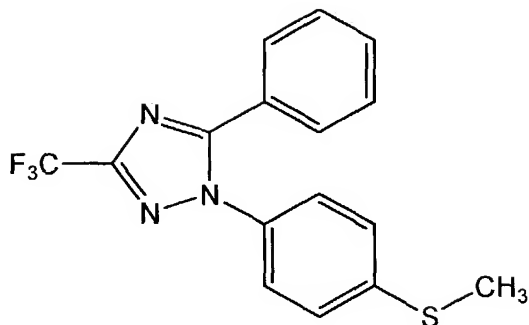
<468>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  2.35(s, 3H), 2.55(s, 3H), 7.15(d, 2H,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.20-7.30(m, 4H), 7.45(d, 1H,  $J=8.0\text{Hz}$ )

<469> 실시예 7

&lt;470&gt; 1-(4-메틸술파닐-페닐)-5-페닐-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸

&lt;471&gt; [화학식 14]

&lt;472&gt;



<473> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 벤조일 클로라이드.

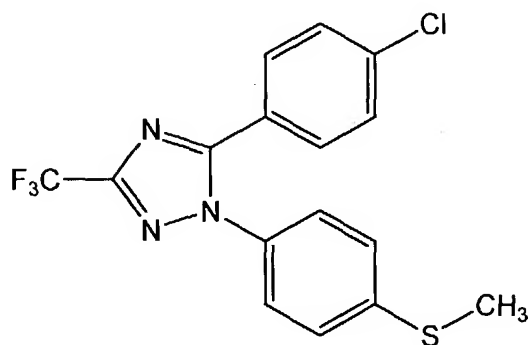
140mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜 오일상의 표제화합물 210mg(수율 71%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

<474> 실시예 8

<475> 5-(4-클로로페닐)-1-(4-메틸술팜닐페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<476> [화학식 15]

&lt;477&gt;



<478> 상기 실시예 6에서, *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 4-클로로벤조일 클로라이드

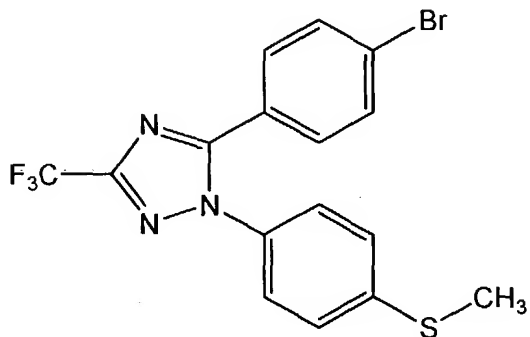
170mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜 오일상의 표제화합물 210mg(수율 65%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

<479> 실시예 9

<480> 5-(4-브로모페닐)-1-(4-메틸술팜닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸

<481> [화학식 16]

<482>



<483> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 4-브로모벤조일 클로라이드

213mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜  
오일상의 표제화합물 280mg(수율 76%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단  
계에 사용하였다.

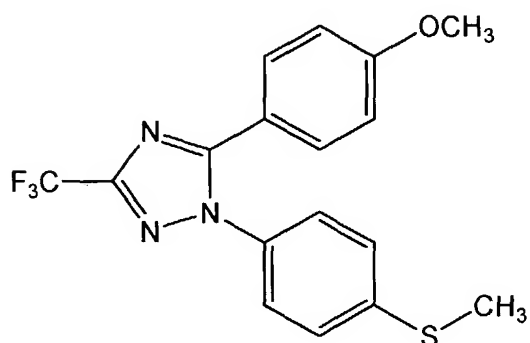
<484> 실시예 10

<485> 1-(4-메틸술팜닐-페닐)-5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아

졸

<486> [화학식 17]

<487>



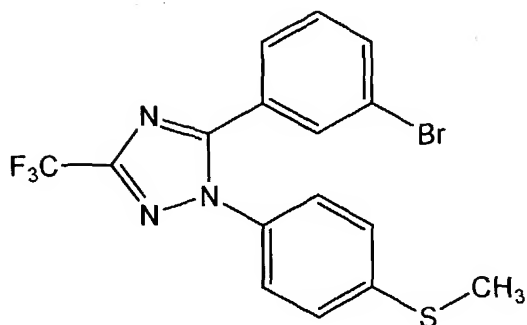
<488> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 *p*-아니소일 클로라이드 165mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜 오일상의 표제화합물 203mg(수율 69%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

<489> 실시예 11

<490> 5-(3-브로모페닐)-1-(4-메틸술파닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<491> [화학식 18]

<492>



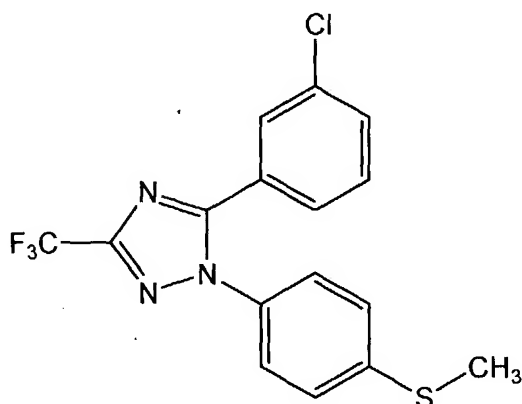
<493> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 3-브로모벤조일 클로라이드 213mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜 오일상의 표제화합물 280mg(수율 76%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

<494> 실시예 12

<495> 5-(3-클로로페닐)-1-(4-메틸술파닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<496> [화학식 19]

&lt;497&gt;



&lt;498&gt;

상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 3-클로로벤조일 클로라이드 170mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜 오일상의 표제화합물 182mg(수율 72%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

&lt;499&gt;

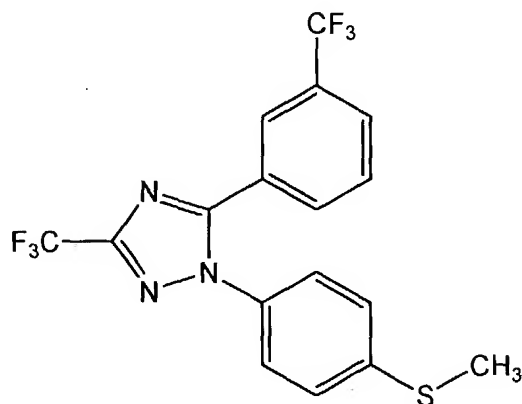
실시예 13

&lt;500&gt;

5-(3-트리플루오로메틸페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

&lt;501&gt; [화학식 20]

&lt;502&gt;



&lt;503&gt;

상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 3-트리플루오로메틸 벤조일 클로라이드 202mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반

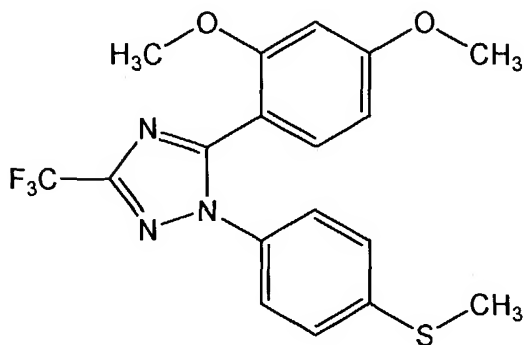
응시커 오일상의 표제화합물 209mg(수율 64%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

<504> 실시예 14

<505> 5-(2,4-디메톡시페닐)-1-(4-메틸술팜페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸

<506> [화학식 21]

<507>



<508> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 2,4-디메톡시벤조일 클로라이드 195mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시커 오일상의 표제화합물 188mg(수율 54%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

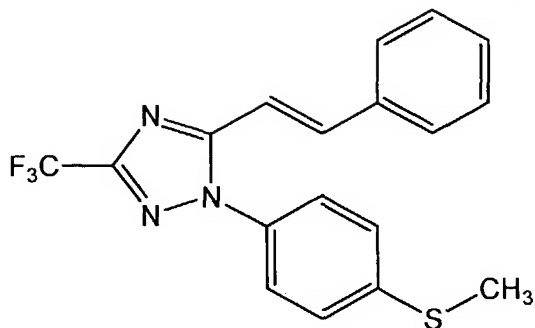
<509> 실시예 15

<510> 5-스티릴-1-(4-메틸술팜페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸

<511> [화학식 22]



&lt;512&gt;



<513> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 시나모일 클로라이드

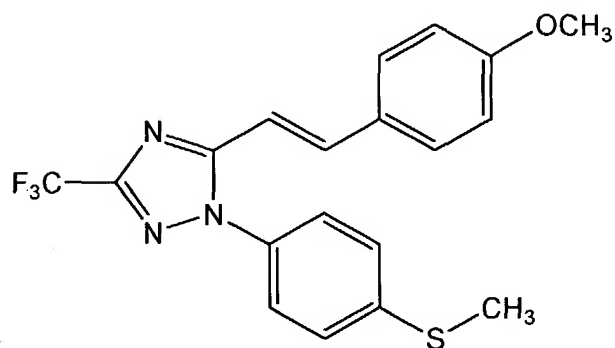
161mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜 오일상의 표제화합물 232mg(수율 73%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

<514> 실시예 16

<515> 5-[2-(4-메톡시페닐)-비닐]-1-(4-메틸술폰페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<516> [화학식 23]

&lt;517&gt;



<518> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 4-메톡시시나모일 클로라이드

191mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜

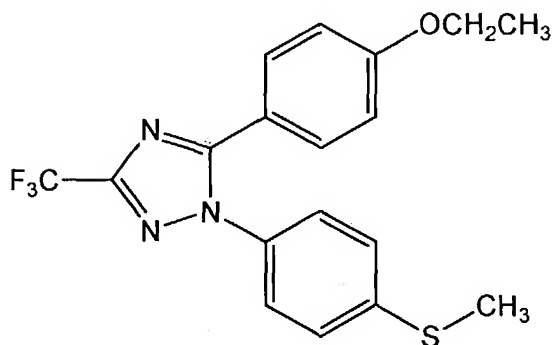
오일상의 표제화합물 189mg(수율 55%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

<519> 실시예 17

<520> 5-(4-에톡시-페닐)-1-(4-메틸술파닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<521> [화학식 24]

<522>



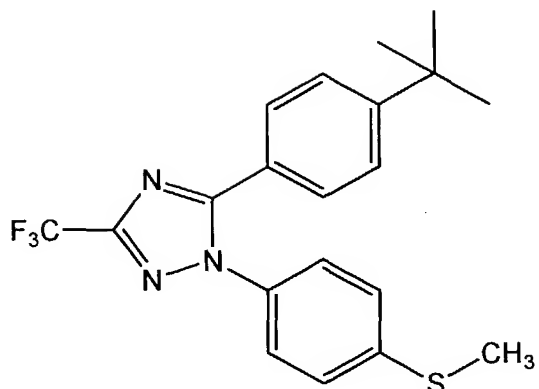
<523> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 4-에톡시벤조일 클로라이드 181mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜 오일상의 표제화합물 243mg(수율 73%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

<524> 실시예 18

<525> 5-(4-*t*-부틸-페닐)-1-(4-메틸술파닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아

<526> [화학식 25]

&lt;527&gt;



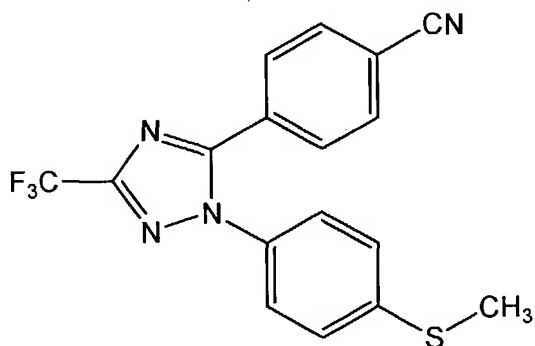
<528> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 4-*t*-부틸벤조일 클로라이드 193mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜 오일상의 표제화합물 282mg(수율 82%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

<529> 실시예 19

<530> 5-(4-시아노-페닐)-1-(4-메틸sul파닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1 $\#$ [1,2,4]트리아  
졸

<531> [화학식 26]

&lt;532&gt;



<533> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 4-시아노벤조일 클로라이드 163mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜

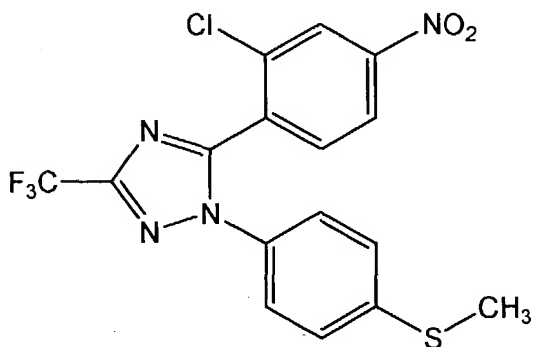
오일상의 표제화합물 165mg(수율 52%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

<534> 실시예 20

<535> 5-(4-니트로-2-클로로-페닐)-1-(4-메틸술팜닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸

<536> [화학식 27]

<537>



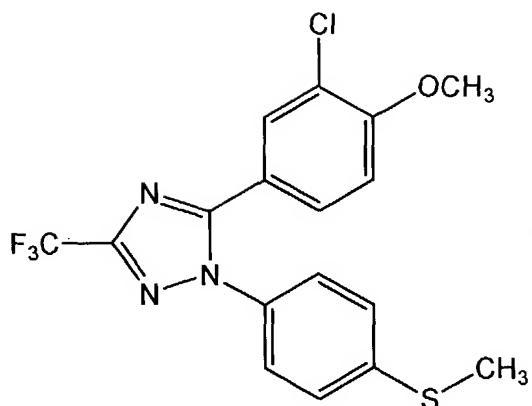
<538> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 4-니트로-2-클로로벤조일 클로라이드 213mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜 오일상의 표제화합물 248mg(수율 68%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

<539> 실시예 21

<540> 5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-1-(4-메틸술팜닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸

<541> [화학식 28]

&lt;542&gt;



<543> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 3-클로로-4-메톡시벤조일 클로라이드 200mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜 오일상의 표제화합물 215mg(수율 61%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정없이 다음 단계에 사용하였다.

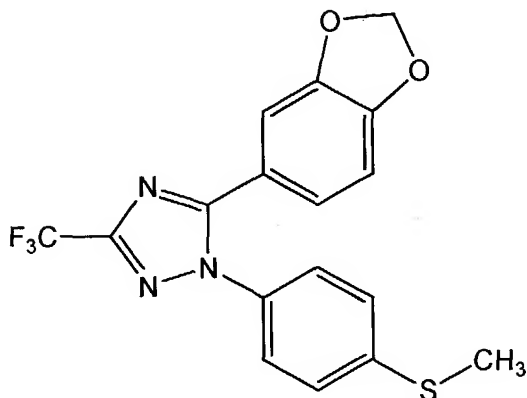
<544> 실시예 22

<545> 5-벤조[1,3]-디옥솔-5-일-1-(4-메틸술파닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]

트리아졸

<546> [화학식 29]

&lt;547&gt;



<548> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 벤조[1,3]-디옥솔-5-일 카보닐 클로라이드 180mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으



1020020046551

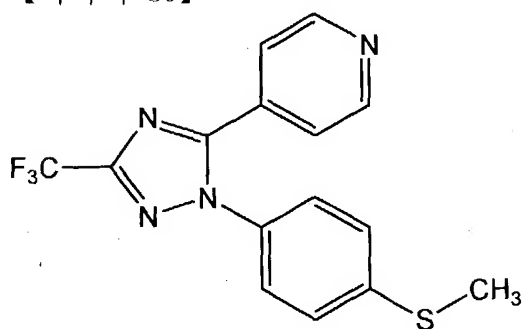
출력 일자: 2003/3/14

로 반응시켜 오일상의 표제화합물 206mg(수율 59%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정 없이 다음 단계에 사용하였다.

<549> 실시예 23

<550> 4-[2-(4-메틸술파닐-페닐)-5-트리플루오로메틸-2H-[1,2,4]트리아졸-3-일]-피리딘

<551> 【화학식 30】



<552> 상기 실시예 6에서 *p*-톨루오일 클로라이드 대신에 이소니코티노일 클로라이드

138mg(0.97mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 6에서와 동일한 방법으로 반응시켜 오일상의 표제화합물 121mg(수율 41%)을 수득하였다. 다른 정제나 확인과정 없이 다음 단계에 사용하였다.

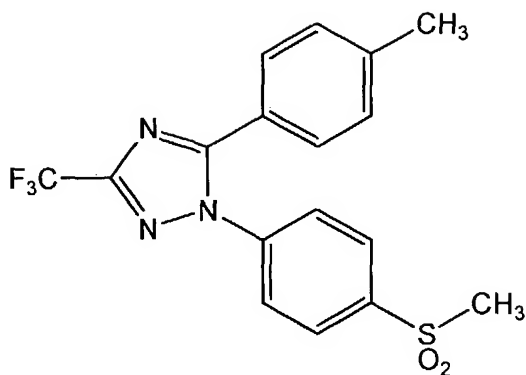
<553> 실시예 24

<554> 1-(4-메틸술파닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<555> 【화학식 31】



&lt;556&gt;



&lt;557&gt;

1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1 $\#$ [1,2,4]트리아졸

310mg(0.89mmole)을 디클로로메탄 10ml와 메탄올 2ml의 혼합용매에 용해 시킨 후 80% MMPP 710mg(1.16mmol)을 천천히 조금씩 가하였다. 반응액을 상온에서 8시간 교반하였다. 반응이 종료된 후 여과한 다음 모액을 증조와 포화 소금물로 각 1회 세척하였다. 무수 황산 마그네슘으로 건조시킨 후 여과, 감압 농축한 다음 속성 컬럼 크로마토그래피(에틸 아세테이트:노르말 헥산=7:3)로 정제하여 고체상의 표제화합물 308mg(수율 91%)을 수득하였다.

&lt;558&gt;

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  2.45(s, 3H), 3.15(s, 3H), 7.23(d, 2H,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.38(d, 2H,  $J=8.2\text{Hz}$ ), 7.63(d, 2H,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 8.03 (d, 2H,  $J=8.7\text{Hz}$ )

&lt;559&gt;

융점 176 $^{\circ}\text{C}$  ~ 178 $^{\circ}\text{C}$ 

&lt;560&gt;

실시예 25

&lt;561&gt;

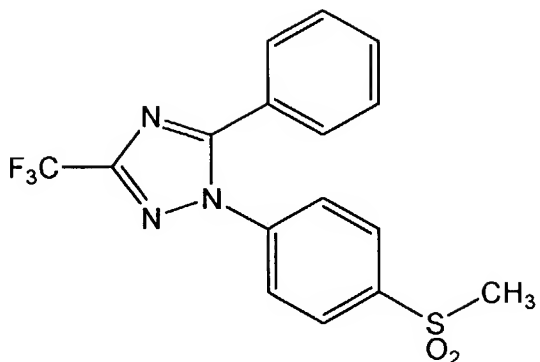
1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-페닐-3-트리플루오로메틸-1 $\#$ [1,2,4]트리아졸

&lt;562&gt;

[화학식 32]



&lt;563&gt;



<564> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*[1,2,4]트리아졸 대신에 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-페닐-3-트리플루오로-1*H*[1,2,4]트리아졸 300mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 283mg(수율 86%)을 수득하였다.

<565>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.15(s, 3H), 7.42-7.48(m, 2H), 7.50-7.55(m, 3H), 7.63(d, 2H,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 8.03 (d, 2H,  $J=8.6\text{Hz}$ )

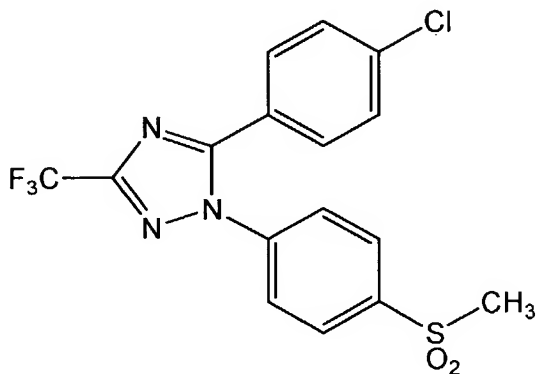
<566> 융점  $153^\circ\text{C} \sim 154^\circ\text{C}$

<567> 실시예 26

<568> 5-(4-클로로페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*[1,2,4]트리아졸

<569> [화학식 33]

&lt;570&gt;







<571> 상기 실시예 24에서, 1-(4-메틸술파닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*[1,2,4]트리아졸 대신에 5-(4-클로로페닐)-1-(4-메틸술파닐-페닐)-3-트리플루오로-1*H*[1,2,4]트리아졸 330mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 294mg(수율 82%)을 수득하였다.

<572>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.15(s, 3H), 7.40-7.50(m, 4H), 7.60(d, 2H,  $J=6.7\text{Hz}$ ), 8.03(d, 2H,  $J=6.7\text{Hz}$ )

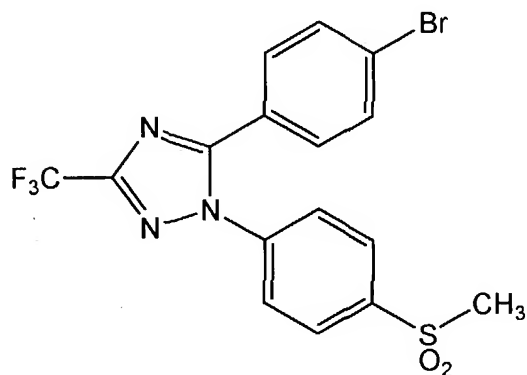
<573> 융점  $190^\circ\text{C} \sim 192^\circ\text{C}$

<574> 실시예 27

<575> 5-(4-브로모페닐)-1-(4-메틸술파닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*[1,2,4]트리아졸

<576> [화학식 34]

<577>



<578> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술파닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*[1,2,4]트리아졸 대신에 5-(4-브로모페닐)-1-(4-메틸술파닐-페닐)-3-트리플루오로-1*H*[1,2,4]트리아졸 370mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 365mg(수율 92%)을 수득하였다.



1020020046551

출력 일자: 2003/3/14

<579>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.15(s, 3H), 7.35(d, 2H,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.50-7.60(m, 4H), 8.03

(d, 2H,  $J=6.3\text{Hz}$ )

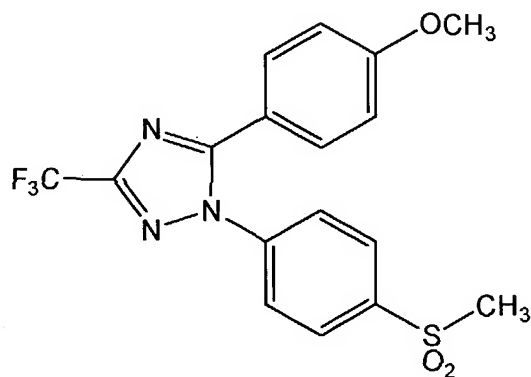
<580> 융점  $198^\circ\text{C} \sim 199^\circ\text{C}$

<581> 실시예 28

<582> 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아  
졸

<583> [화학식 35]

<584>



<585> 상기 실시예 24에서, 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 대신에 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-(4-메톡시페닐)-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 325mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 300mg(수율 85%)을 수득하였다.

<586>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.15(s, 3H), 3.90(s, 3H), 6.90(d, 2H,  $J=6.9\text{Hz}$ ), 7.35(d, 2H,  $J=6.9\text{Hz}$ ), 7.65(d, 2H,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 8.03(d, 2H,  $J=8.7\text{Hz}$ )

<587> 융점  $155^\circ\text{C} \sim 156^\circ\text{C}$

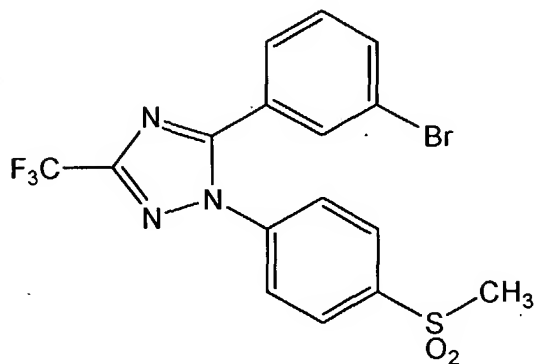
<588> 실시예 29



<589> 5-(3-브로모페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<590> [화학식 36]

<591>



<592> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 대신에 5-(3-브로모페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 370mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 365mg(수율 92%)을 수득하였다.

<593>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.15(s, 3H), 7.35-7.72(m, 6H), 7.92 (d, 2H,  $J=8.7\text{Hz}$ )

<594> 융점  $195^\circ\text{C} \sim 196^\circ\text{C}$

<595> 실시예 30

<596> 5-(3-클로로페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<597> [화학식 37]



&lt;598&gt;

<599> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술폰파닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*[1,2,4]트리아졸 대신에 5-(3-클로로페닐)-1-(4-메틸술폰파닐-페닐)-3-트리플루오로-1*H*[1,2,4]트리아졸 330mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 326mg(수율 91%)을 수득하였다.

<600>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.11(s, 3H), 7.00(d, 1H,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 7.28(t, 1H), 7.35(d, 1H,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 7.62(s, 1H), 7.64(d, 2H,  $J=9.2\text{Hz}$ ), 8.09(d, 2H,  $J=9.2\text{Hz}$ )

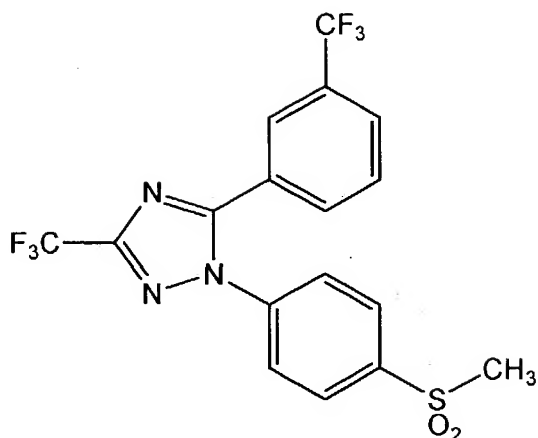
<601> 융점  $188^\circ\text{C} \sim 190^\circ\text{C}$

<602> 실시예 31

<603> 5-(3-트리플루오로메틸페닐)-1-(4-메틸술폰파닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<604> [화학식 38]

&lt;605&gt;



<606> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 대신에 5-(3-트리플루오로메틸-페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 360mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 340mg(수율 88%)을 수득하였다.

<607>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.10(s, 3H), 7.56(t, 1H), 7.61-7.64(m, 3H), 7.79(d, 1H,  $J$  = 4.0Hz), 7.86(s, 1H), 8.09(d, 2H,  $J$  = 8.8Hz)

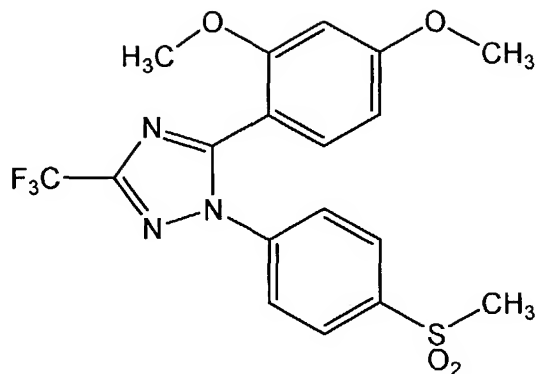
<608> 융점 135°C ~ 137°C

<609> 실시예 32

<610> 5-(2,4-디메톡시페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<611> [화학식 39]

&lt;612&gt;



<613> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 대신에 5-(2,4-디메톡시-페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 350mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 357mg(수율 94%)을 수득하였다.

<614>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.11(s, 3H), 3.26(s, 3H), 3.84(s, 3H), 6.34(d, 1H,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 6.66(dd, 1H,  $J=8.4\text{Hz}$ ,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 7.58(d, 1H,  $J=8.4\text{Hz}$ ), 7.69(d, 2H,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.98(d, 2H,  $J=8.8\text{Hz}$ )

<615> 융점  $110^\circ\text{C} \sim 112^\circ\text{C}$

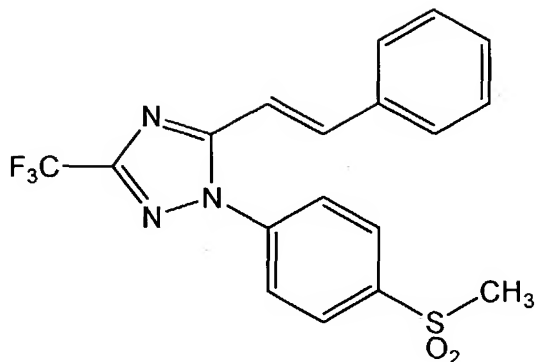
<616> 실시예 33

<617> 5-스티릴-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<618> [화학식 40]



&lt;619&gt;



<620> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 대신에 5-스티릴-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 320mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 287mg(수율 82%)을 수득하였다.

<621>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.15(s, 3H), 6.83(d, 2H,  $J=15\text{Hz}$ ), 7.39-7.41(m, 3H), 7.52-7.54(m, 2H), 7.82(d, 2H,  $J=12\text{Hz}$ ), 8.01(d, 1H,  $J=15\text{Hz}$ ), 8.21(d, 2H,  $J=12\text{Hz}$ ),

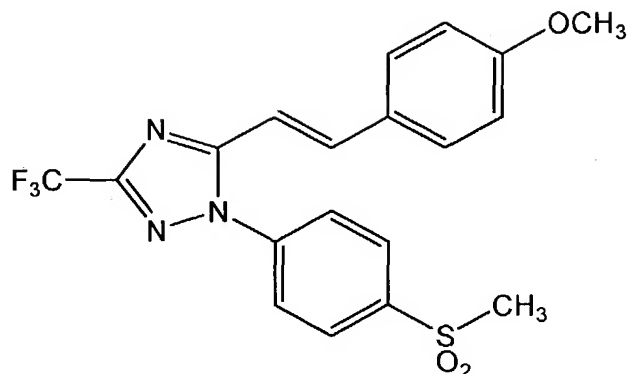
<622> 융점  $168^\circ\text{C} \sim 170^\circ\text{C}$

<623> 실시예 34

<624> 5-[2-(4-메톡시페닐)-비닐]-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<625> [화학식 41]

&lt;626&gt;



<627> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*[1,2,4]트

리아졸 대신에

5-[2-(4-메톡시페닐)-비닐]-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*[1,2,4]트리아졸 378mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 340mg(수율 91%)을 수득하였다.

<628>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.17(s, 3H), 3.85(s, 3H), 6.75(d, 1H,  $J=12.8\text{Hz}$ ), 6.96(d, 2H,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 7.50(d, 2H,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 7.82(d, 2H,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 7.95(d, 1H,  $J=12.8\text{Hz}$ ), 8.21(d, 2H,  $J=6.8\text{Hz}$ )

<629> 실시예 35

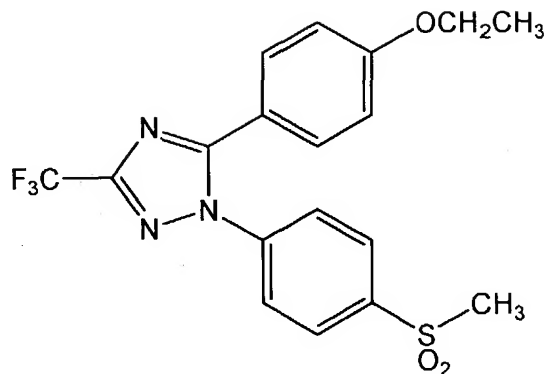
<630> 5-(4-에톡시-페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*[1,2,4]트리아졸

<631> [화학식 42]





&lt;632&gt;



<633> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술파닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*[1,2,4]트리아졸 대신에 5-(4-에톡시-페닐)-1-(4-메틸술파닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸 337mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 300mg(수율 82%)을 수득하였다.

<634>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.45(t, 3H,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 3.15(s, 3H), 4.10(q, 4H,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 6.91(d, 2H,  $J=8.9\text{Hz}$ ), 7.45(d, 2H,  $J=8.9\text{Hz}$ ), 7.65(d, 2H,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 8.05(d, 2H,  $J=8.7\text{Hz}$ )

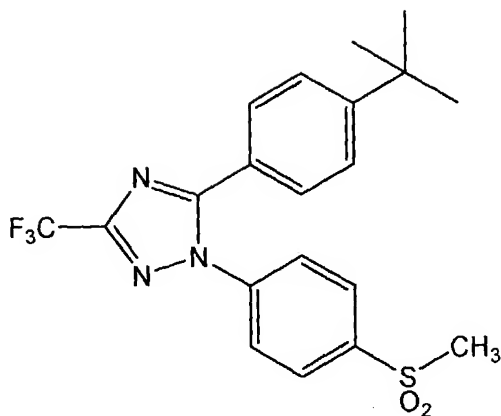
<635> 융점  $152^\circ\text{C} \sim 154^\circ\text{C}$

<636> 실시예 36

<637> 5-(4-*t*-부틸-페닐)-1-(4-메틸술파닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*[1,2,4]트리아  
졸

<638> [화학식 43]

&lt;639&gt;



<640> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 대신에 5-(4-*t*-부틸-페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸 348mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 343mg(수율 91%)을 수득하였다.

<641>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.30(s, 9H), 3.15(s, 3H), 7.45(s, 4H), 7.68(d, 2H,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.08(d, 2H,  $J=9.0\text{Hz}$ )

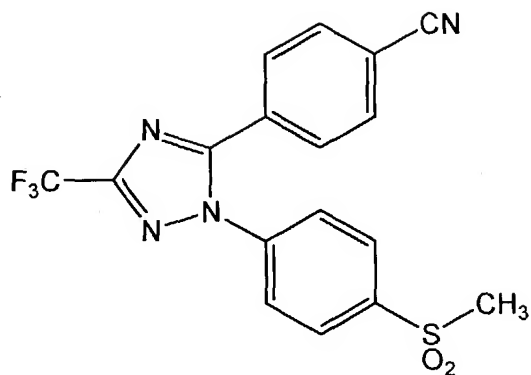
<642> 융점  $81^\circ\text{C} \sim 82^\circ\text{C}$

<643> 실시예 37

<644> 5-(4-시아노-페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<645> [화학식 44]

&lt;646&gt;



<647> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술파닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 대신에 5-(4-시아노-페닐)-1-(4-메틸술파닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸 320mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 320mg(수율 92%)을 수득하였다.

<648>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.15(s, 3H), 7.64(d, 2H,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.68(d, 2H,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.75(d, 2H,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 8.13(d, 2H,  $J=8.7\text{Hz}$ )

<649> 융점 109°C ~ 111°C

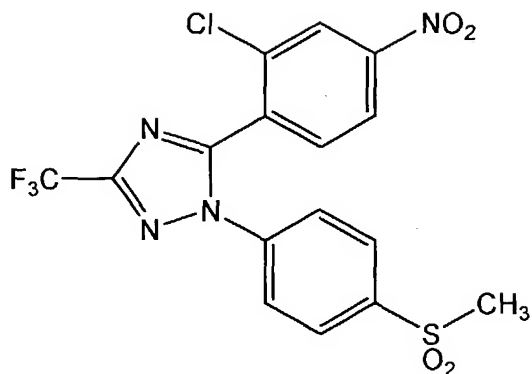
<650> 실시예 38

<651> 5-(4-니트로-2-클로로-페닐)-1-(4-메틸술파닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<652> [화학식 45]



&lt;653&gt;



<654> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 대신에 5-(4-니트로-2-클로로-페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸 369mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 314mg(수율 79%)을 수득하였다.

<655>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.15(s, 3H), 7.51(d, 2H,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.83(d, 1H,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 7.97(d, 2H,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 8.29(d, 1H,  $J=2.1\text{Hz}$ ), 8.32(s, 1H)

<656> 융점  $110^\circ\text{C} \sim 111^\circ\text{C}$

<657> 실시예 39

<658> 5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

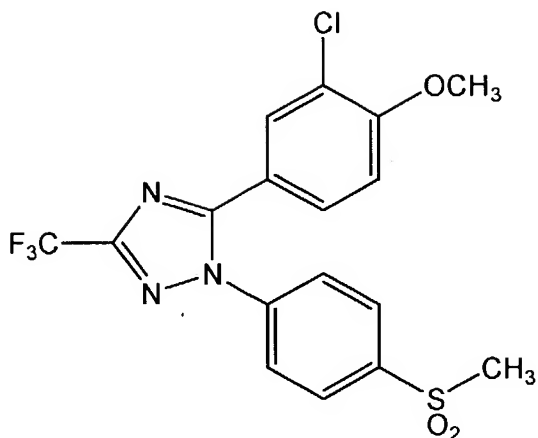
<659> [화학식 46]



1020020046551

출력 일자: 2003/3/14

&lt;660&gt;



<661> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 대신에 5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸 356mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 319mg(수율 83%)을 수득하였다.

<662>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.15(s, 3H), 3.95(s, 3H), 6.90(d, 1H,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.25(dd, 1H,  $J_F=8.6\text{Hz}$ ,  $J_2=2.5\text{Hz}$ ), 7.75(dd, 2H,  $J_F=6.8\text{Hz}$ ,  $J_2=2.0\text{Hz}$ ), 7.76(d, 1H,  $J=2.5\text{Hz}$ ), 8.08(dd, 2H,  $J_F=8.6\text{Hz}$ ,  $J_2=2.0\text{Hz}$ )

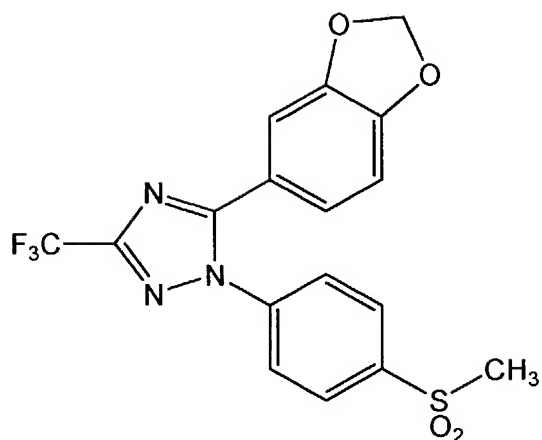
<663> 실시예 40

<664> 5-벤조[1,3]-디옥솔-5-일-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸

<665> [화학식 47]



&lt;666&gt;



<667> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술폰파닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 대신에 5-벤조[1,3]-디옥솔-5-일-1-(4-메틸술폰파닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1*H*-[1,2,4]트리아졸 337mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 322mg(수율 88%)을 수득하였다.

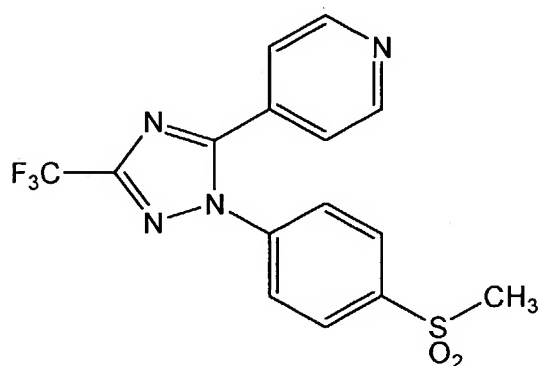
<668>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.15(s, 3H), 6.05(s, 2H), 6.82(d, 1H,  $J=7.5\text{Hz}$ ), 6.97-7.02(m, 2H), 7.65(d, 2H,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 8.05(d, 2H,  $J=8.6\text{Hz}$ )

<669> 실시예 41

<670> 4-[2-(4-메틸술폰파닐-페닐)-5-트리플루오로메틸-2*H*-[1,2,4]트리아졸-3-일]-피리딘

<671> [화학식 48]

&lt;672&gt;





1020020046551

출력 일자: 2003/3/14

<673> 상기 실시예 24에서 1-(4-메틸술폰아닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트

리아졸 대신에

4-[2-(4-메틸술폰아닐-페닐)-5-트리플루오로메틸-2*H*-[1,2,4]트리아졸-3-일]-피리딘

299mg(0.89mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 24에서와 동일한 방법으로 반응시

켜 고체상의 표제화합물 244mg(수율 72%)을 수득하였다.

<674>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.15(s, 3H), 7.45(d, 2H,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 7.65(d, 2H,  $J=8.0\text{Hz}$ ),

8.10(d, 2H,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 8.75(d, 2H,  $J=6.0\text{Hz}$ )

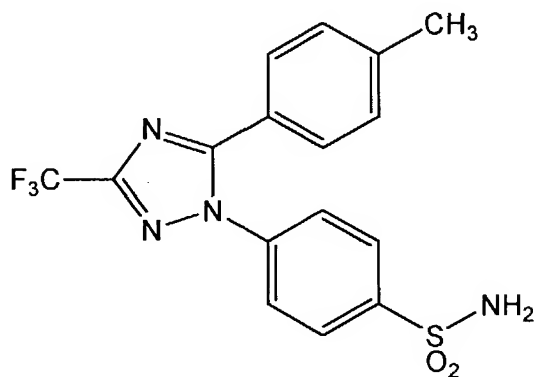
<675> 융점  $180^\circ\text{C} \sim 182^\circ\text{C}$

<676> 실시예 42

<677> 4-(5-*p*-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드

<678> [화학식 49]

<679>



<680> 1-(4-메틸술폰아닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸

120mg(0.32mmole)을 무수의 테트라하이드로퓨란 2ml에 녹인 후 온도를  $0^\circ\text{C}$ 로 맞췄다. 여

기에 메틸 마그네슘 클로라이드 테트라하이드로퓨란 용액(3M solution)

0.18ml(0.54mmole)을 적가한 후 반응액의 온도를 상온으로 올려 3시간동안 교반하였다.

반응액에 트리부틸보란 테트라하이드로퓨란 1M 용액을 0.9ml(0.90mmole) 적가한 후 18시간동안 환류시켜 교반하였다. 반응액의 온도를 0℃ 로 내린 후 히드록시아민-O-술폰산 150mg(1.34mmole)과 아세트산 나트륨 256mg(3.20mmole)을 물 2ml에 녹인 용액을 천천히 적가한 다음 반응액을 상온에서 3시간동안 교반하였다. 반응이 종료되면 물과 에틸 아세테이트를 가하여 교반한 후 반응액을 에틸아세테이트로 3회 추출한 다음 유기층을 포화 소금물로 1회 세척하였다. 무수 황산 마그네슘으로 건조한 후 감압 여과, 감압 농축한 다음 속성 컬럼 크로마토그래피(에틸 아세테이트:노르말 헥산=7:3)로 정제하여 고체상의 표제화합물 63mg(수율 52%)을 수득하였다.

<681>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  2.45(s, 3H), 7.20(d, 2H,  $J=8.2\text{Hz}$ ), 7.35(d, 2H,  $J=8.2\text{Hz}$ ), 7.52(s, 2H), 7.70(d, 2H,  $J=6.6\text{Hz}$ ), 7.98 (d, 2H,  $J=6.0\text{Hz}$ )

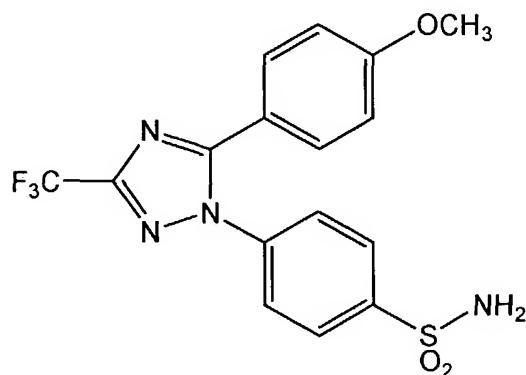
<682> 융점 245℃ ~ 247℃

<683> 실시예 43

<684> 4-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드

<685> [화학식 50]

<686>







<687> 상기 실시예 42에서 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-*p*-톨릴-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 대신에 1-(4-메틸술폰닐-페닐)-5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로-1*H*-[1,2,4]트리아졸 127mg(0.32mmol)을 사용하는 점을 제외하고는 실시예 42에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 68mg(수율 53%)을 수득하였다.

<688>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  3.85(s, 3H), 6.96(d, 2H,  $J=6.9\text{Hz}$ ), 7.45(d, 2H,  $J=6.9\text{Hz}$ ), 7.55(s, 3H), 7.75(d, 2H,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.95 (d, 2H,  $J=8.6\text{Hz}$ )

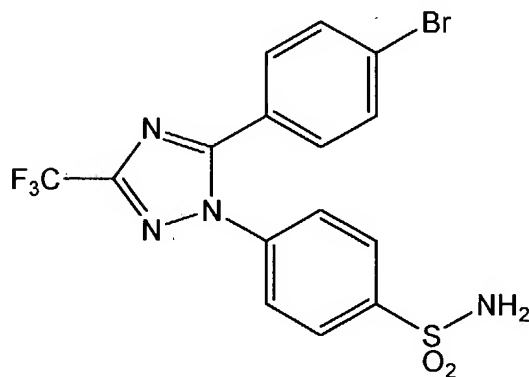
<689> 융점 : 251-253°C

<690> 실시예 44

<691> 4-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드

<692> [화학식 51]

<693>



<694> N-(4-술폰아미도-페닐)-트리플루오로아세트아미드라존 250mg(0.88mmole)을 5ml의 1,4-디옥산에 용해시킨 다음 피리딘 0.08ml(0.97mmol)를 적가하였다. 반응액을 상온에서 10분간 교반 후 4-브로모벤조일 클로라이드 212mg(0.97mmol)을 적가하였다. 반응액을 끓는점에서 24시간동안 환류시켜 교반하였다. 반응이 종료된 후, 반응액의 온도를 상온으로 내린 다음 반응액에 물과 에틸 아세테이트를 넣은 후 물층을 에틸 아세테이트로 2

회 추출한 다음 유기층을 포화 소금물로 1회 세척하고 무수 황산마그네슘으로 건조한 후 여과하였다. 감압여과로 얻어진 반응물을 속성 컬럼 크로마토그래피(에틸 아세테이트:노르말 헥산=1:1)로 정제하여 오일상의 표제화합물 208mg(수율 53%)을 얻었다.

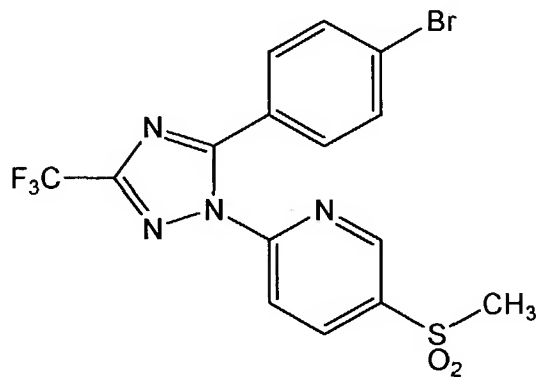
<695>  $^1\text{H-NMR}(400\text{MHz}, \text{CDCl}_3)$   $\delta$  4.95(br, s, 2H), 7.39(d, 2H,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.58-7.62(m, 4H), 8.05(d, 2H,  $J=8.7\text{Hz}$ )

<696> 실시예 45

<697> 2-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리딘

<698> [화학식 52]

<699>



<700> N-(5-메틸술포닐-피리딘-2-일)-트리플루오로아세트아미드라존 130mg(0.46mmole)을 5ml의 1,4-디옥산에 용해시킨 다음 피리딘 0.04ml(0.51mmol)를 적가하였다. 반응액을 상온에서 10분간 교반 후 4-브로모벤조일 클로라이드 115mg(0.51mmol)을 적가하였다. 반응액을 110℃에서 24시간동안 환류시켜 교반하였다. 반응이 종료된 후, 반응액의 온도를 상온으로 내린 다음 반응액에 물과 에틸 아세테이트를 넣은 후 물층을 에틸 아세테이트로 2회 추출한 다음 유기층을 포화 소금물로 1회 세척하고 무수 황산마그네슘으로 건조

한 후 여과하였다. 감압여과로 얻어진 반응물을 속성 컬럼 크로마토그래피(에틸 아세테이트:노르말 헥산=3:7)로 정제하여 고체상의 표제화합물 107mg(수율 52%)을 얻었다.

<701>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.42(s, 3H), 7.55(d, 2H,  $J=6.7\text{Hz}$ ), 7.70(d, 2H,  $J=6.7\text{Hz}$ ), 8.15(d, 1H,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 8.65(dd, 1H,  $J_F=8.5\text{Hz}$ ,  $J_F=2.1\text{Hz}$ ), 8.95(d, 1H,  $J=2.1\text{Hz}$ )

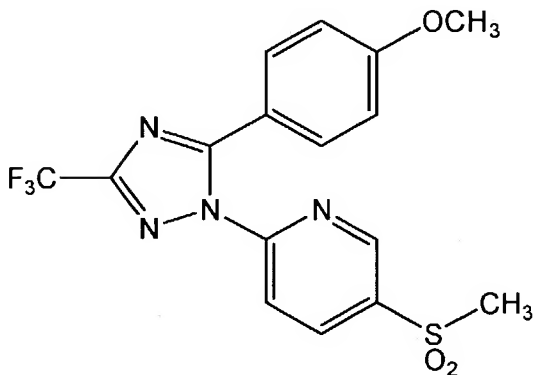
<702> 융점 : 143~145°C

<703> 실시예 46

<704> 2-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-파리딘

<705> [화학식 53]

<706>



<707> 상기 실시예 45에서 4-브로모벤조일 클로라이드 대신에 *p*-아니소일 클로라이드 87mg(0.51mmole)을 사용한 점을 제외하고는 실시예 45에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 108mg(수율 59%)을 수득하였다.

<708>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.25(s, 3H), 3.85(s, 3H), 6.90(d, 2H,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 7.50(d, 2H,  $J=6.7\text{Hz}$ ), 7.95(d, 1H,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 8.45(dd, 1H,  $J_F=8.5\text{Hz}$ ,  $J_F=2.1\text{Hz}$ ), 8.95(d, 1H,  $J=2.1\text{Hz}$ )

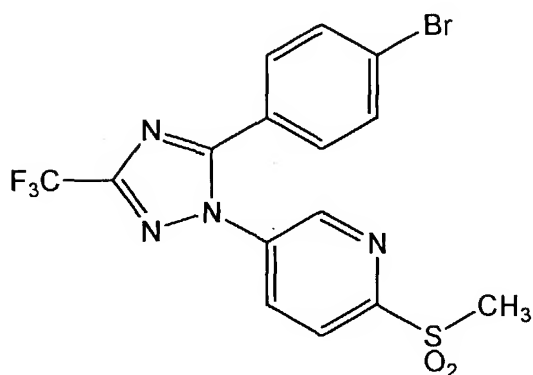
<709> 융점 : 138~139°C

<710> 실시예 47

<711> 2-메탄술폰닐-5-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-  
피리딘

<712> [화학식 54]

<713>



<714> N-(2-메틸술폰닐-피리딘-5-일)-트리플루오로아세트아미드라존 130mg(0.46mmole)을 5ml의 1,4-디옥산에 용해시킨 다음 피리딘 0.04ml(0.51mmol)를 적가하였다. 반응액을 상온에서 10분간 교반 후 4-브로모벤조일 클로라이드 115mg(0.51mmol)을 적가하였다. 반응액을 110℃에서 24시간동안 환류시켜 교반하였다. 반응이 종료된 후, 반응액의 온도를 상온으로 내린 다음 반응액에 물과 에틸 아세테이트를 넣은 후 물층을 에틸 아세테이트로 2회 추출한 다음 유기층을 포화 소금물로 1회 세척하고 무수 황산마그네슘으로 거조한 후 여과하였다. 감압여과로 얻어진 반응물을 속성 컬럼 크로마토그래피(에틸 아세테이트:노르말 헥산=3:7)로 정제하여 고체상의 표제화합물 107mg(수율 52%)을 얻었다.

<715>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.42(s, 3H), 7.55(d, 2H,  $J=6.7\text{Hz}$ ), 7.70(d, 2H,  $J=6.7\text{Hz}$ ), 8.22(d, 1H,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 8.55(dd, 1H,  $J_F=8.5\text{Hz}$ ,  $J=2.1\text{Hz}$ ), 8.95(d, 1H,  $J=2.1\text{Hz}$ )

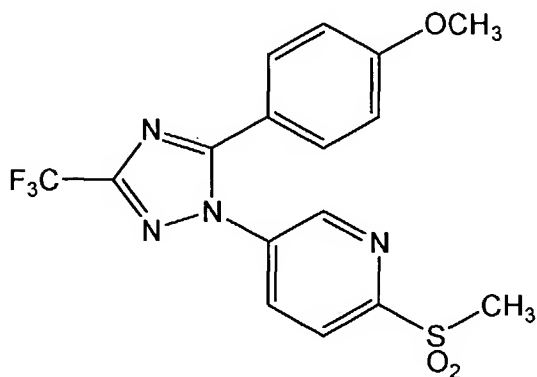
<716> 융점 : 141~143℃

<717> 실시예 48

<718> 2-메탄술포닐-5-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-  
파리딘

<719> [화학식 55]

<720>



<721> 상기 실시예 47에서 4-브로모 벤조일클로라이드 대신에 *p*-아니소일 클로라이드 87mg(0.51mmole)을 사용한 점을 제외하고는 실시예 47에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 108mg(수율 59%)을 수득하였다.

<722>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.25(s, 3H), 3.85(s, 3H), 6.90(d, 2H,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 7.50(d, 2H,  $J=6.7\text{Hz}$ ), 7.85(d, 1H,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 8.35(dd, 1H,  $J_1=8.5\text{Hz}$ ,  $J_2=2.1\text{Hz}$ ), 8.90(d, 1H,  $J=2.1\text{Hz}$ )

<723> 융점 : 136~137°C

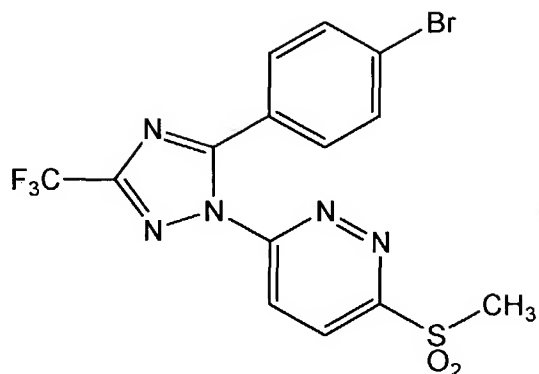
<724> 실시예 49

<725> 3-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-  
파리다진

<726> [화학식 56]



&lt;727&gt;



&lt;728&gt;

N-(6-메틸술포닐-피리다진-3-일)-트리플루오로아세트아미드라존 310mg(1.09mmole)을 10ml의 1,4-디옥산에 용해시킨 다음 피리딘 0.10ml(1.20mmol)를 적가하였다. 반응액을 상온에서 10분간 교반 후 4-브로모벤조일 클로라이드 264mg(1.20mmol)을 적가하였다. 반응액을 110℃ 에서 24시간동안 환류시켜 교반하였다. 반응이 종료된 후, 반응액의 온도를 상온으로 내린 다음 반응액에 물과 에틸 아세테이트를 넣은 후 물층을 에틸 아세테이트로 2회 추출한 다음 유기층을 포화 소금물로 1회 세척하고 무수 황산마그네슘으로 거조한 후 여과하였다. 감압여과로 얻어진 반응물을 속성 컬럼 크로마토그래피(에틸 아세테이트:노르말 헥산=3:7)로 정제하여 고체상의 표제화합물 220mg(수율 45%)을 얻었다.

&lt;729&gt;

$^1\text{H-NMR}(400\text{MHz}, \text{CDCl}_3)$   $\delta$  3.42(s, 3H), 7.55(d, 2H,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.62(d, 2H,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 8.38(d, 1H,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.45(d, 1H,  $J=9.0\text{Hz}$ )

&lt;730&gt;

융점 : 174~181℃

&lt;731&gt;

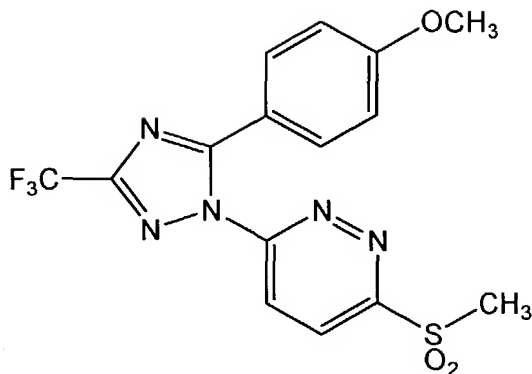
실시예 50

&lt;732&gt;

3-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진

&lt;733&gt; [화학식 57]

&lt;734&gt;



<735> 상기 실시예 49에서 4-브로모벤조일 클로라이드 대신에 *p*-아니소일 클로라이드 205mg(0.51mmole)을 사용한 점을 제외하고는 실시예 49에서와 동일한 방법으로 반응시켜 고체상의 표제화합물 183mg(수율 42%)을 수득하였다.

<736>  $^1\text{H-NMR}$ (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.42(s, 3H), 3.85(s, 3H), 6.85(d, 2H,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 7.55(d, 2H,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 8.20(d, 1H,  $J=9.1\text{Hz}$ ), 8.35(d, 1H,  $J=9.1\text{Hz}$ )

<737> 융점 : 185~186°C

<738> 실험예

<739> 1. 사이클로옥시게나제-2에 대한 선택적 저해활성 측정

<740> 실험 방법

<741> 본 발명에 따른 화합물의 사이클로옥시게나제-2 효소에 대한 선택적 저해활성을 약리학적으로 검증하기 위하여, 사이클로옥시게나제-1 및 사이클로옥시게나제-2에 대한 효소 저해작용을 각각 다음과 같은 방법으로 측정하였다.

<742> 가. U-937을 이용한 사이클로옥시게나제-1의 억제 효과 검색

<743> 배양된 U-937(Human lymphoma cell)(입수처 : 한국세포주은행, 기탁번호 : 21593)을 원심분리하여 모은 후 1xHBSS(Hank's balanced salt solution)를 이용하여  $1 \times 10^6$  cells/ml

농도로 희석하여 12-웰 플레이트의 각 웰 당 1ml씩 분주하였다. 여기에 DMSO에 녹여 1 $\mu$  M로 희석한 검색시료 용액과 DMSO를 5 $\mu$  l씩 넣고 섞은 후, CO<sub>2</sub> 배양기에서 37℃로 15분간 배양하였다. 기질로 사용되는 아라키돈산을 10mM 농도로 에탄올에 녹여서 만든 스탁용액을 1xHBSS로 10배 희석하여 1mM 용액을 준비하였다. 물질을 처리한 각 웰에 1mM 아라키돈산 용액을 10 $\mu$  l씩 가하여 섞은 후 CO<sub>2</sub> 배양기에서 37℃로 30분간 배양하였다. 각 웰의 세포용액을 원심분리 시험관에 모은 후 4℃, 10,000rpm에서 5분간 원심분리하였다. 원심분리로 모아진 세포와 분리된 상층액 중에 존재하는 PGE<sub>2</sub>의 농도를 모노클로날 키트(Cayman Chemicals사)를 이용하여 정량하고, 실험물질 처리군의 농도를 DMSO 군의 농도와 비교하여 각 물질의 PGE<sub>2</sub> 생성 억제율을 구함으로서 사이클로옥시게나제-1 효소에 대한 물질의 억제효과를 구하였다.

<744> 나. Raw 264.7 세포주를 이용한 사이클로옥시게나제-2 억제 효과 검색

<745> Raw 264.7 세포(입수처 : 한국세포주은행, 기탁번호 : 40071)를 12 웰 플레이트의 각 웰 당 2x10<sup>6</sup> 개씩 접종한 후 아스피린 250 $\mu$  M을 처리하여, 37℃에서 2시간 배양하였다. 새로운 배지로 갈아준 후, 각각의 검색시료(10nM 농도)를 처리하고 30분 배양하였다. 여기에 각 웰 당 인터페론  $\gamma$  (100 유닛/ml)와 리포폴리사카라이드(LPS, 100ng/ml)를 처리한 후 18시간 배양하였다. 그 다음 배지를 다른 시험관에 옮겨 담은 후, EIA 키트(Cayman Chemicals)를 이용하여 PGE<sub>2</sub> 정량을 하였다.

<746> 2) 실험 결과

<747> 실험결과는 하기 표 1에 나타내었다.





<748> %억제 = (인터페론 $\gamma$  및 LPS에 대한 보정된 PGE2 농도 - 검색시료에 대한 보정된 PGE2 농도) / (인터페론 $\gamma$  및 LPS에 대한 보정된 PGE2 농도) X 100

<749> [표 1]

<750> 사이클로옥시게나제(COX) 저해 효과(단위: % inhibition)

<751> 화합물	COX-1(1 $\mu$ M)	COX-2(10nM)
기준물질(Valdecoxib)	28.8	5.47
실시예 25	29.2	7.62
실시예 26	38.8	10.53
실시예 27	13.8	16.04
실시예 28	10.1	28.62
실시예 29	16.7	6.23
실시예 30	18.6	7.32
실시예 31	16.5	5.66
실시예 32	19.9	12.6
실시예 33	19.2	19.23
실시예 34	23.5	26.82
실시예 35	11.8	38.65
실시예 36	21.6	6.23
실시예 37	23.7	8.92
실시예 38	19.5	5.95
실시예 39	12.5	32.62
실시예 40	18.7	33.73
실시예 41	16.7	8.88
실시예 42	38.0	12.08
실시예 43	34.6	32.32
실시예 44	23.1	29.86
실시예 45	14.6	33.63
실시예 46	12.6	42.32
실시예 47	21.9	4.26
실시예 48	28.8	5.63
실시예 49	14.6	3.21
실시예 50	10.6	4.32

<752> 3) 평가

<753> 상기 사이클로옥시게나제-1 및 사이클로옥시게나제-2의 저해에 관한 in vitro 실험결과를 고찰해보면 다음과 같다.



<754> 실시예 24 내지 50의 사이클로옥시게나제-1의 억제%에 대한 사이클로옥시게나제-2의 억제%의 비율이 기준물질(valdecoxib) 보다 거의 동일하거나 현저히 우수한 것으로 나타났다. 이는 사이클로옥시게나제-1에 대한 사이클로옥시게나제-2의 선택적 억제효과가 기준물질과 거의 동일하거나 현저히 우수함을 나타낸다. 특히 실시예 28의 1-(4-메틸술폰닐페닐)-5-(4-메톡시페닐)-3-트리플루오로-1H[1,2,4]트리아졸, 실시예 35의 1-(4-메틸술폰닐페닐)-5-(4-에톡시페닐)-3-트리플루오로-1H[1,2,4]트리아졸, 실시예 39의 5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸, 실시예 40의 5-벤조[1,3]-디옥솔-5-일-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸, 실시예 44의 4-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드, 실시예 45의 2-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘 및 실시예 46의 2-[5-(4-메톡시페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘의 경우에 있어서 사이클로옥시게나제-2의 억제효과가 기준물질(valdecoxib)보다 월등하게 우수한 동시에 사이클로옥시게나제-1의 억제효과는 비슷하거나 현저히 떨어져서 선택성이 뛰어난 것으로 입증되었다.

<755> 또한, 사이클로옥시게나제-2에 대하여 실시예 47, 49, 50를 제외하고는 모두 기준물질보다 높은 저해 효과를 나타내었다. 이러한 결과는 선택성의 향상으로 인해 기준물질보다 부작용이 개선되었을 뿐만 아니라 해열진통소염 효과면에서도 더 우수하다는 것을 보여준다.

<756> 2. 랫트의 카라기난 유도 발부종 시험

<757> 1) 실험방법

<758> 랫트를 시험개시 전날 체중에 따라 군을 분리하고 사료를 빼내 절식시킨 후 시험당일 준비된 시험물질 및 대조물질을 경구 투여하였다. 경구투여 1 시간 후에 플레디스모미터 (plethysmometer)를 이용하여 왼쪽 뒷발의 일정부분까지의 부피( $V_{oh}$ )를 측정하고, 준비된 1 % 카라기난(carrageenan) 용액 100  $\mu$  l 를 1 ml 주사기로 취하여 왼쪽 뒷발의 피하에 주사하였다. 카라기난 투여후 3 시간에 왼쪽 뒷발의 일정부분까지의 부피( $V_{3h}$ )를 측정한 후, 왼쪽 뒷발의 일정부분까지의 부피의 각 시험물질 투여군에서의 증가( $T_{3h} - T_{oh}$ ) 를 대조물질 투여군의 증가( $C_{3h} - C_{oh}$ )와 비교하고, 대조군(대조물질 투여군)을 0 % 억제(inhibition)으로 보았을 때, 각 시험물질의 억제 %를 구하였다.

<759> 2) 실험결과

<760> 실험결과는 하기 표 2에 나타내었다.

<761> [표 2]

<762> 사이클로옥시게나제(COX) 저해 효과(단위: % inhibition)

화합물	억제 효과 (단위 : % inhibition)
기준물질 1 (Indomethacine)	40.1
기준물질 2 (Celecoxib)	23.9
실시예 27	21.7
실시예 28	23.3
실시예 34	19.3
실시예 35	32.3
실시예 43	39.1
실시예 44	28.8
실시예 45	21.6
실시예 46	33.4

<764> 3) 평가

<765> 상기 사이클로옥시게나제 저해에 관한 in vivo 실험결과를 고찰해보면 다음과 같다.

<766> 실시예 27 내지 46의 사이클로옥시게나제의 억제%의 비율이 기준물질(Celecoxib) 보다 거의 동일하거나 현저히 우수한 것으로 나타났다. 이는 사이클로옥시게나제에 대한 억제 효과가 기준물질과 거의 동일하거나 현저히 우수함을 나타낸다. 특히 실시예 35의 1-(4-메틸술폰닐페닐)-5-(4-에톡시페닐)-3-트리플루오로-1H-[1,2,4]트리아졸, 실시예 43의 4-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드, 실시예 44의 4-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드, 및 실시예 46의 2-[5-(4-메톡시페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘의 경우에 있어서 사이클로옥시게나제의 억제효과가 기준물질 (Celecoxib)보다 월등하게 우수한 것으로 입증되었다.

<767> 또한, 사이클로옥시게나제에 대하여 실시예 34를 제외하고는 모두 기준물질 (Celecoxib)보다 높거나 비슷한 저해 효과를 나타내었다. 이러한 결과는 해열진통소염 효과면에서 더 우수하다는 것을 보여준다.

#### 【발명의 효과】

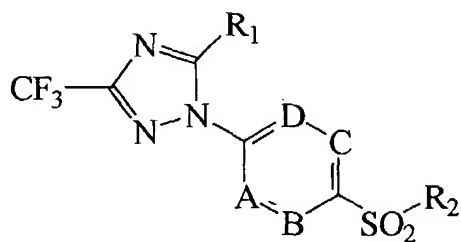
<768> 본 발명에 따르면 종래의 비스테로이드성 소염제의 부작용이 개선되어 특히 소화성 궤양, 위염, 부분적인 장염, 궤양성 대장염, 게실염, 위장내 출혈 또는 저트롬빈혈증 등이 있는 환자들에게 유용하게 사용할 수 있으며 해열, 진통, 소염 효과를 갖는 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염, 이들의 제조방법 그리고 이들을 유효성분으로 함유하는 약제학적 조성물을 제공할 수 있다.

## 【특허청구범위】

## 【청구항 1】

하기 화학식 1로 표시되는 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염:

[ 화학식 1 ]



상기에서 ,

R<sub>1</sub>은 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> 시클로알킬; C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> 시클로알케닐; 페닐; C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>

할로알킬, C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 알콕시, C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 할로알콕시, 할로젠, 아미노, 모노알킬아미노, 디알킬아미노, 니트로, 및 시아노로 이루어진 군으로부터 선택된 기로 하나 이상 치환된 페닐; 스티레닐; C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 알콕시 스티레닐; 피리딜이고,

R<sub>2</sub>는 메틸 또는 아미노이고,

A,B,C, 및 D는 각각 독립적으로 탄소 또는 질소를 나타낸다.

## 【청구항 2】

제 1 항에 있어서,

1-(4- 메탄술폰닐-페닐)-5-페닐-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

5-(4-브로모-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

5-(3-브로모페닐)-1-(4-메탄술폰닐페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(4-플루오로-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]  
트리아졸;

5-(4-클로로-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(3,4-디클로로-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(3,4-디메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸  
;

5-(3,4-디플루오로-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아  
졸;

1-(4-메탄술폰닐-페닐)-5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(3,4-디메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

1-(4-메탄술폰닐-페닐)-5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(3,4-디메틸-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리  
아졸;

5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아  
졸;

5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트  
리아졸;

5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

5-(3-플루오로-4-메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메틸-페닐)-1H-[1,2,4]트리아졸;

5-(4-메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

1-(4-메탄술폰닐-페닐)-5-(4-트리플루오로메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

5-(4-*t*-부틸-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

5-(4-시아노-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

5-[4-(N-메틸아미노)-페닐]-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

5-[4-(N,N-디메틸아미노)-페닐]-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

5-(4-아미노-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸;

5-(3-트리플루오로메틸-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(3-메톡시-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

1-(4-메탄술포닐-페닐)-5-m-톨릴-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

1-(4-메탄술포닐-페닐)-5-o-톨릴-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(2-브로모-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(2-메톡시-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(2,4-디플루오로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(2,5-디플루오로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(2,4,5-트리플루오로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(2,3-

디클로로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(2,4-디클로로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(3,5-디플루오로-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(3,5-디메톡시-페닐)-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;



5-(2,4-

디메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(3,4,5-트리메톡시-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(2-

플루오로-4-트리플루오로메틸-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(2-클로로-4-니트로-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(2,4- 디클로로-5-플루오로-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5- 벤조[1,3]디옥솔-5-일-1-(4-메탄술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-메탄술폰닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5- 메탄술폰닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-에톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘 ;

5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5- 메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-*t*-부틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘  
;

5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-시아노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5- 메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘  
;

5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-N-메틸아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-  
피리딘;

5- 메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(4-N,N-디메틸아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-  
일]-피리딘;

5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3-메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5- 메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-  
일]-피리딘;

5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3-메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5- 메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-  
피리딘;

5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,5-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-  
피리딘;

5- 메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4,5-트리플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,3-디클로로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5- 메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디클로로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3,5-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5- 메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3,5-디메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5- 메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3,4,5-트리플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2-플루오로-4-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5- 메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2-클로로-4-니트로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5-메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디클로로-5-플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5- 메탄술포닐-2-[3-트리플루오로메틸-5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

2-(5-벤조[1,3]디옥솔-5-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-5-메탄술포닐-피리딘;

3-[2-(4- 메탄술포닐-페닐)-5-트리플루오로메틸-2H[1,2,4]트리아졸-3-일]-피리딘;

4-[2-(4-메탄술포닐-페닐)-5-트리플루오로메틸-2H[1,2,4]트리아졸-3-일]-피리딘;

5- 시클로헥실-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

5-시클로헥센-1-일-1-(4-메탄술포닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H[1,2,4]트리아졸;

4-(5- 페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드;

4-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[5-(4- 플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;  
;

4-[5-(4- 클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[5-(4- 메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-(5-p- 톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드;

4-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[5-(3- 클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[5-(3- 클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[5-(3- 플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[5-(3- 플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3- 트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-트리플루오로메틸-5-(4-메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3- 트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-트리플루오로메틸-5-(4-*t*-부틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3- 트리플루오로메틸-5-(4-시아노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-트리플루오로메틸-5-(4-아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3- 트리플루오로메틸-5-(4-N-메틸아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-트리플루오로메틸-5-(4-N,N-디메틸아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3- 트리플루오로메틸-5-*m*-톨릴-1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-트리플루오로메틸-5-(3-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-트리플루오로메틸-5-(3-메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3- 트리플루오로메틸-5-(2-브로모-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-트리플루오로메틸-5-(2-메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3- 트리플루오로메틸-5-(2,4-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-트리플루오로메틸-5-(2,5-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드

;

4-[3- 트리플루오로메틸-5-(2,4,5-트리플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-트리플루오로메틸-5-(2,3-디클로로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3- 트리플루오로메틸-5-(2,4-디클로로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-트리플루오로메틸-5-(3,5-디메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3- 트리플루오로메틸-5-(2,4-디메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-트리플루오로메틸-5-(3,4,5-트리플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-

트리플루오로메틸-5-(2-플루오로-4-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-트리플루오로메틸-5-(2-클로로-4-니트로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3- 트리플루오로메틸-5-(2,4-디클로로-5-플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-[3-트리플루오로메틸-5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-벤젠술폰아미드;

4-(5-

벤조[1,3]디옥솔-5-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드;

4-(5-피리딘-3-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드;

4-(5- 피리딘-4-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드;

4-(5-시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드;

4-(5- 시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-벤젠술폰아미드;

5-메탄술폰닐-2-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘;

2-[5-(4-

브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;

2-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;

2-[5-(3,4- 디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;

2-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;

2-[5-(3,4- 디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;

5-메탄술폰닐-2-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

2-[5-(3,4- 디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;

5-메탄술폰닐-2-(5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘;

2-[5-(3,4- 디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;



2-[5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-  
피리딘;

2-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-  
피리딘;

6-[5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-  
술포산 아마이드;

6-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-  
술포산 아마이드;

6-[5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-  
술포산 아마이드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-  
술포산 아마이드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술포산 아미  
드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-트리플루오로메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘  
-3-술포산 아마이드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-*t*-부틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술포산 아미  
드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-시아노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술포산 아  
미드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-[3- 트리플루오로메틸-5-(4-N-메틸아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(4-N,N-디메틸아미노-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-[3- 트리플루오로메틸-5-*m*-톨릴-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(3-메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-[3- 트리플루오로메틸-5-(3-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(2-브로모-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-[3- 트리플루오로메틸-5-(2-메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-[3- 트리플루오로메틸-5-(2,5-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(3,5-디플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

6-[3- 트리플루오로메틸-5-(2,4,5-트리플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(2-플루오로-4-트리플루오로메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

6-[3- 트리플루오로메틸-5-(2,4-디메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(3,4,5-트리메톡시-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

6-[3- 트리플루오로메틸-5-(2-클로로-4-니트로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

6-[3-트리플루오로메틸-5-(2,4-디플루오로-5-플루오로-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

6-[3- 트리플루오로메틸-5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아마이드;

2-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;

2-[5-(3- 플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리딘;

2-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄  
술포닐-피리딘;

5- 메탄술포닐-2-((3-피리디닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일))-피리딘;

5-메탄술포닐-2-((4-피리디닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일))-피리딘;

2-(5- 시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-5-메탄술포닐-피리딘;

2-(5-시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-5-메탄술포닐-피리딘;

6-(5- 페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-3-술포산 아마이드;

6-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술포산 아미  
드;

6-[5-(4- 플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술포산  
아미드;

6-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술포  
산 아마이드;

6-[5-(4- 클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술포산 아  
미드;

6-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술포산  
아미드;

6-[5-(4- 메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술포산 아  
미드;

6-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산  
아미드;

6-(5-p- 톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아  
미드;

6-[5-(3- 클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰  
산 아미드;

6-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰  
산 아미드;

6-[5-(3- 클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-  
술폰산 아미드;

6-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰  
산 아미드;

6-[5-(3- 플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-  
술폰산 아미드;

6-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰  
산 아미드;

6-[5-(3- 플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘  
-3-술폰산 아미드;

6-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-(5- 피리딘-3-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-(5-피리딘-4-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-(5- 시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-3-술폰산 아미드;

6-(5-시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-3-술폰산 아미드;

2- 메탄술폰닐-5-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘;

5-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술폰닐-피리딘;

5-[5-(4- 플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술폰닐-피리딘;

5-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술폰닐-피리딘;

5-[5-(4- 클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술폰닐-피리딘 ;

5-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술폰닐-피리딘;

2-

메탄술폰닐-5-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘;

5-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술포닐-피리딘;

2- 메탄술포닐-5-(5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘;

5-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술포닐-피리딘;

5-[5-(3-

클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술포닐-피리딘;

5-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술포닐-피리딘;

5-[5-(3- 클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산 아마이드;

5-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산 아마이드;

5-[5-(3- 플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산 아마이드;

5-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술포닐-피리딘;

5-[5-(3- 플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄술포닐-피리딘;

5-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-2-메탄  
술포닐-피리딘;

5-(5- 시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-2-메탄술포닐-피리딘;

5-(5-시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-2-메탄술포닐-피리딘;

5-(5- 페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-2-술포산 아마이드;

5-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산 아마  
이드;

5-[5-(4- 플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산  
아מיד;

5-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포  
산 아마이드;

5-[5-(4- 클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산 아  
מיד;

5-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산  
아מיד;

5-[5-(4- 메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산 아  
מיד;

5-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술포산  
아מיד;

5-(5-p- 톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-2-술포산 아마이드;



5-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;

5-[5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;

5-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;

5-[5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;

5-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;

5-[5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;

5-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;

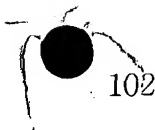
5-[5-(3-플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;

5-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리딘-2-술폰산 아미드;

5-(5-피리딘-3-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-2-술폰산 아미드;

5-(5-피리딘-4-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-2-술폰산 아미드;

- 5-(5-시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-2-술폰산 아미드;
- 5-(5-시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리딘-2-술폰산 아미드;
- 3-메탄술폰닐-6-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진;
- 3-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술폰닐-피리다진;
- 3-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술폰닐-피리다진;
- 3-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술폰닐-피리다진;
- 3-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술폰닐-피리다진;
- 3-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술폰닐-피리다진;
- 3-메탄술폰닐-6-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진;
- 3-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술폰닐-피리다진;
- 3-메탄술폰닐-6-(5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진;



3-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;

3-[5-(3-

클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;  
;

3-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;

3-[5-(3- 클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;

3-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;

3-[5-(3- 플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;

3-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;

3-[5-(3- 플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;

3-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-6-메탄술포닐-피리다진;

3- 메탄술포닐-6-(5-피리딘-3-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진;

3-메탄술포닐-6-(5-피리딘-4-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진;

3-(5-시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-6-메탄술포닐-피리다진;

3-(5-시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-6-메탄술포닐-피리다진;

6-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진-3-술포산 아마이드;

6-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;

6-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;

6-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;

6-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;

6-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;

6-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;

6-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술포산 아마이드;

6-(5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진-3-술포산 아마이드;

6-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술폰산  
아미드;

6-[5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-  
술폰산 아미드;

6-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-술폰산  
아미드;

6-[5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진  
-3-술폰산 아미드;

6-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-  
술폰산 아미드;

6-[5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진  
-3-술폰산 아미드;

6-[5-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진-3-  
술폰산 아미드;

6-[5-(3-플루오로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다진  
-3-술폰산 아미드;

6-[5-(3,5-디클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리다  
진-3-술폰산 아미드;

6-(5-피리딘-3-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진-3-술폰산 아미  
드;

6-(5-피리딘-4-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진-3-술폰산

아미드;

6-(5-시클로헥실-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진-3-술폰산 아미드

;

6-(5-시클로헥센-1-일-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리다진-3-술폰산 아

미드;

5-메탄술폰닐-2-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리미딘;

2-[5-(4-브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리미

딘;

2-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리

미딘;

2-[5-(3,4-디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-

피리미딘;

2-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피리미

딘;

2-[5-(3,4-디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술폰닐-피

리미딘;

5-메탄술폰닐-2-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미

딘;

2-[5-(3,4-디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리미딘;

5- 메탄술포닐-2-(5-*p*-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리미딘;

2-[5-(3,4-디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리미딘;

2-[5-(3-

클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리미딘 ;

2-[5-(4-클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리미딘;

2-[5-(3- 클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리미딘;

2-[5-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리미딘;

2-[5-(3- 플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-5-메탄술포닐-피리미딘;

2-(5-페닐-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리미딘-5-술포산 아마이드;

2-[5-(4- 브로모-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술포산 아마이드;

2-[5-(4-플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산  
아미드;

2-[5-(3,4- 디플루오로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰  
산 아미드;

2-[5-(4-클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아  
미드;

2-[5-(3,4- 디클로로-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰  
산 아미드;

2-[5-(4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산 아  
미드;

2-[5-(3,4- 디메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰  
산 아미드;

2-(5-p-톨릴-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일)-피리미딘-5-술폰산 아미드;

2-[5-(3,4- 디메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰산  
아미드;

2-[5-(3-클로로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-술폰  
산 아미드;

2-[5-(4- 클로로-3-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-  
술폰산 아미드;



2-[5-(3-클로로-4-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-  
술폰산 아마이드;

2-[5-(4- 클로로-3-메톡시-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘  
-5-술폰산 아마이드;

2-[5-(3-플루오로-4-메틸-페닐)-3-트리플루오로메틸-[1,2,4]트리아졸-1-일]-피리미딘-5-  
술폰산 아마이드;

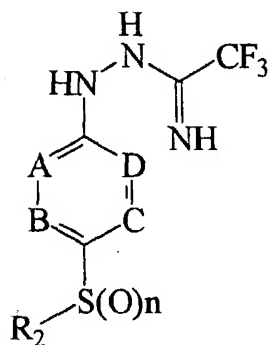
5-스티릴-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리아졸; 및

5-[2-(4-메톡시페닐)-비닐]-1-(4-메틸술폰닐-페닐)-3-트리플루오로메틸-1H-[1,2,4]트리  
아졸로 구성된 군으로부터 선택된 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염.

### 【청구항 3】

하기 화학식 4로 표시되는 아마이드라존 유도체:

[ 화학식 4 ]

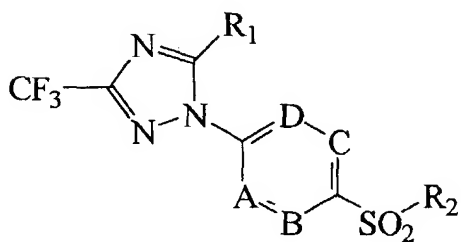


상기에서, R<sub>2</sub>, A, B, C, 및 D는 제1항에서 정의한 바와 같고, n은 0 내지 2의 정수  
이다.

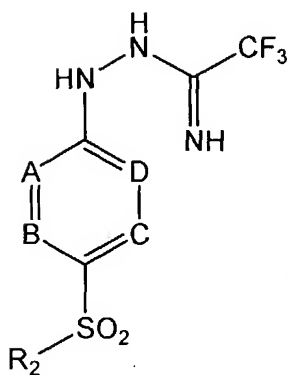
## 【청구항 4】

화학식 4a의 아미드라존 유도체와 화학식 5의 아실클로라이드를 염기 존재하에서 반응시키는 단계를 포함하는 화학식 1의 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염의 제조방법:

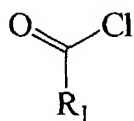
[ 화학식 1]



[ 화학식 4a]



[ 화학식 5]



상기에서, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, A, B, C, 및 D는 제1항에서 정의한 바와 같다.

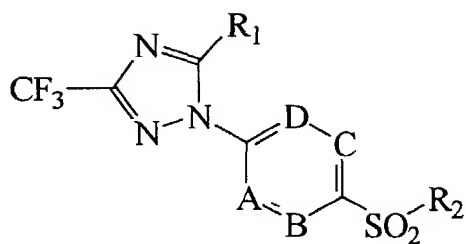
## 【청구항 5】

화학식 4b의 아미드라존 유도체와 화학식 5의 아실클로라이드를 염기 존재하에서 반응시키고, MMPP (Magnesium monoperoxyphthalate hexahydrate),

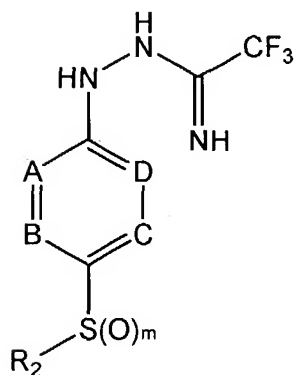
MCPBA(m-chloroperoxybenzoic acid), 및 Oxone (Potassium peroxymonosulfate)로 구성된

군으로부터 선택된 산화제로 산화시키는 단계를 포함하는 화학식 1의 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염의 제조방법:

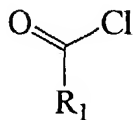
## [ 화학식 1 ]



## [ 화학식 4b ]



## [ 화학식 5 ]

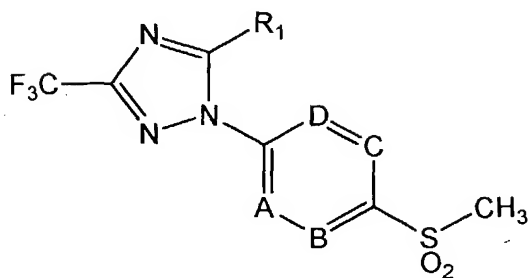


상기에서,  $R_1$ ,  $R_2$ , A, B, C, 및 D는 제1항에서 정의한 바와 같고, m은 0 또는 1이다.

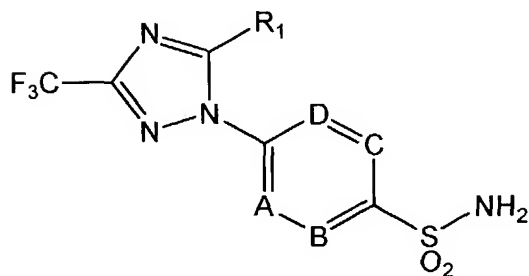
#### 【청구항 6】

화학식 1a의 화합물과 히드록시아민 또는 그의 염을 강염기 및 루이스산의 존재하에서 반응시키는 단계를 포함하는 화학식 1b의 화합물의 제조방법:

[ 화학식 1a]



[ 화학식 1b]

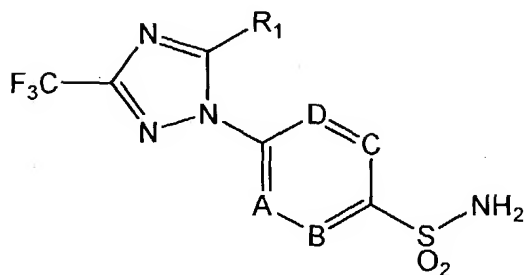


상기에서,  $R_1$ , A, B, C, 및 D는 제1항에서 정의한 바와 같다.

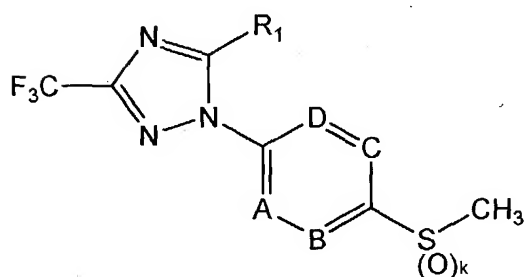
## 【청구항 7】

화학식 6a의 화합물과 히드록시아민 또는 그의 염을 강염기 및 루이스산의 존재하에서 반응시키고, MMPP (Magnesium monoperoxyphthalate hexahydrate), MCPBA(m-chloroperoxybenzoic acid), 및 Oxone (Potassium peroxymonosulfate)로 구성된 군으로부터 선택된 산화제로 산화시키는 단계를 포함하는 화학식 1b의 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염의 제조방법:

## [ 화학식 1b]



## [ 화학식 6a]

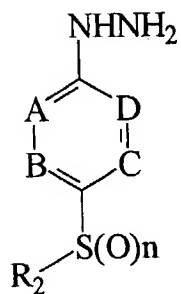


상기에서,  $R_1$ , A, B, C, 및 D는 제1항에서 정의한 바와 같고 k는 0 또는 1이다.

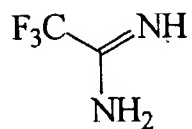
## 【청구항 8】

화학식 2의 히드라진 유도체와 화학식 3의 트리플루오로아세트이미딘을 염기의 존재 하에서 반응시키는 단계를 포함하는 화학식 4의 화합물의 제조방법.

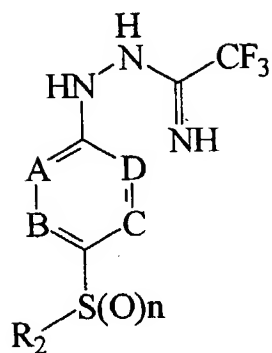
[ 화학식 2]



[ 화학식 3]



[ 화학식 4]



상기에서,  $R_2$ , A, B, C, D, 제 1하에서 정의한 바와 같고,  $n$ 은 0 내지 2의 정수이다.

**【청구항 9】**

치료학적으로 유효한 양의 제1항에 따른 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염을 유효성분으로 함유하고 약제적으로 허용 가능한 담체를 포함하는 해열, 진통, 소염 효과를 갖는 약제학적 조성물.

**【청구항 10】**

치료학적으로 유효한 양의 제1항에 따른 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염을 유효성분으로 함유하고 약제적으로 허용 가능한 담체를 포함하는 암 치료용 약제학적 조성물.

**【청구항 11】**

치료학적으로 유효한 양의 제1항에 따른 1,2,4-트리아졸 유도체 또는 그의 무독성 염을 유효성분으로 함유하고 약제적으로 허용 가능한 담체를 포함하는 치매 치료용 약제학적 조성물.